

DIABETES MELLITUS-TREATING AGENT

Publication number: JP8012579 (A)

Publication date: 1996-01-16

Inventor(s): KOMATSU MAKOTO; SATO HIDEAKI; TAIRA SHINICHI;
MIYAKE MASAHITO; MAGATA KIYOHICO; YOSHIDA
HIDEHIRO; UHEYAMA ATSUNORI; NISHI TAKAO +

Applicant(s): OTSUKA PHARMA CO LTD +

Classification:

- international: **A61K31/495; A61K31/535; A61P3/08; A61P3/10; C07D241/44;
C07D403/06; C07D413/06; A61K31/495; A61K31/535;
A61P3/00; C07D241/00; C07D403/00; C07D413/00;** (IPC1-
7): A61K31/495; A61K31/535; C07D241/44; C07D403/06;
C07D413/06

- European:

Application number: JP19940259309 19940928

Priority number(s): JP19940259309 19940928; JP19930241140 19930928;
JP19940114639 19940428

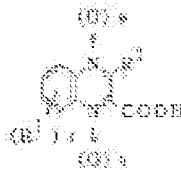
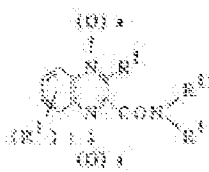
Also published as:

JP2759257 (B2)

Abstract of JP 8012579 (A)

PURPOSE:To obtain a diabetes mellitus treating agent containing a novel quinoxaline derivative not acting on insulin secretion and sugar release in liver and having hypoglycemic action which is not drastic and useful as a treating medicine for diabetes mellitus and various diabetic complications, etc.

CONSTITUTION:A quinoxaline derivative is expressed by formula I [R<1> is H, a halogen, a lower alkyl, a lower alkoxy, etc.; R<2> is H, a (halogen-substituted) lower alkyl, phenyl, a morpholino-substituted lower alkyl, etc.; (n) is 0; (m) is 0 or 1; (r) is 1 or 2; R<3> and R<4> are each H, a lower alkyl, a phenyl-lower alkyl alkoxycarbonyl, a lower alkanoyloxy-substituted lower alkyl, etc., with the proviso that when R<1> is H, R<2> is methyl, R<3> is H and (m) is 0, R<4> is not 2-(imidazolyl-2-yl)ethyl, sec-butyl, etc.] or its salt, e.g. 2-[(3-benzofuranyl) methylaminocarbonyl]-3-methylquinoxaline-4-oxide. The compound of formula I is obtained by reacting, e.g. a compound of formula I with a compound of formula III.



(19)日本国特許庁 (J P)

(12) 公 開 特 許 公 報 (A)

(11)特許出願公開番号

特開平8-12579

(43)公開日 平成8年(1996)1月16日

(51)Int.Cl. ⁶	識別記号	庁内整理番号	F I	技術表示箇所
A 6 1 K 31/495	AD P			
31/535				
C 0 7 D 241/44				
403/06	2 3 3			
413/06	2 4 1			

審査請求 有 請求項の数2 F D (全316頁)

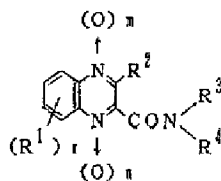
(21)出願番号	特願平6-259309	(71)出願人	000206956 大塚製薬株式会社 東京都千代田区神田司町2丁目9番地
(22)出願日	平成6年(1994)9月28日	(72)発明者	小松 真 徳島県板野郡松茂町笹木野字八山開拓91番地の5
(31)優先権主張番号	特願平5-241140	(72)発明者	佐藤 英昭 徳島県鳴門市撫養町小桑島字前浜151番地
(32)優先日	平5(1993)9月28日	(72)発明者	平良 伸一 徳島県鳴門市撫養町立岩字五枚188番地
(33)優先権主張国	日本 (J P)	(74)代理人	弁理士 三枝 英二 (外4名)
(31)優先権主張番号	特願平6-114639		
(32)優先日	平6(1994)4月28日		
(33)優先権主張国	日本 (J P)		

最終頁に続く

(54)【発明の名称】 糖尿病治療剤

(57)【要約】 (修正有)

【構成】 下記式



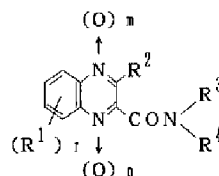
〔式中、R¹ は水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基など、R² は水素原子、置換基としてハロゲン原子を有してもよい低級アルキル基、フェニル基など、nは0、mは1又は2、rは1又は2、R³ 及びR⁴ は水素原子、低級アルキル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基などを示す〕で表されるキノキサリン誘導体。

【効果】 上記化合物は糖尿病治療剤として有効である。

【特許請求の範囲】

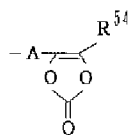
【請求項1】 一般式

【化1】



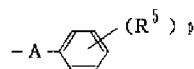
〔式中R¹は水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基を示す。R²は水素原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、フェニル基、モルホリノ置換低級アルキル基又はイミダゾリル置換低級アルキル基を示す。nは0を示す。mは0又は1を示す。rは1又は2を示す。R³及びR⁴は同一又は異なって、それぞれ a) 水素原子； b) 低級アルキル基； c) フェニル低級アルコキシカルボニル基； d) 低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基； e) 低級アルカノイル基； f) 低級アルコキシカルボニル基； g) 低級アルコキシ低級アルキル基； h) フェノキシカルボニル基； i) 低級アルカノイル基置換低級アルキル基； j) 低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基； k) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基； l) 基—E—R⁵²R⁵³（R⁵²及びR⁵³は、同一又は異なって水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基又はフェニル基を示す。R⁵²及びR⁵³は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5員又は6員環の飽和複素環を形成してもよい。Eは低級アルキレン基、基—C(=O)—又は基—C(=O)—A—（Aは低級アルキレン基）を示す。）； m) 基

【化2】



〔式中Aは前記に同じ。R⁵⁴は水素原子又は低級アルキル基を示す。）； n) 基

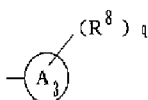
【化3】



〔式中Aは低級アルキレン基を示す。pは1～3の整数を示す。R⁵は低級アルコキシ置換低級アルコキシ基、低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有す

ることのあるアミノ基、ハロゲン原子、ニトロ基、水酸基、置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基、低級アルケニルオキシ基、カルボキシ置換低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、水酸基置換低級アルコキシ基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及び低級アルコキシ基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのある1, 3-ジオキサニル基、低級アルカノイル基、モルホリノ置換低級アルコキシ基、モルホリノ置換低級アルキル基、モルホリノカルボニル基又は、基—Y—A₁—CONR⁶R⁷（ここでA₁は低級アルキレン基、Yは基—O—又は基—NH—を示す。R⁶及びR⁷は同一又は異なって、水素原子、置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基、フリル置換低級アルキル基又は低級アルコキシ置換低級アルキル基を示す。またR⁶とR⁷とは、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく又は6員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環には、置換基として水酸基、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基を1～3個有してもよい。）を示す。）； o) フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基—O—A₄—CO—NR⁴⁰R⁴¹（A₄は低級アルキレン基を示す。R⁴⁰及びR⁴¹は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。またR⁴⁰及びR⁴¹は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5員又は6員の飽和複素環を形成してもよい。）； p) 低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基； q) シクロアルキル低級アルキル基； r) ナフチル低級アルキル基； s) フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基； t) フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基； u) フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基； v) フェノキシ置換低級アルキル基； w) 基

【化4】



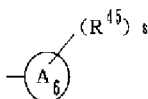
(式中qは1～3の整数を示す。)

【化5】



は、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子なる群より選ばれたヘテロ原子を1～4個有する5～14員環の単環、二項環又は三項環の飽和又は不飽和複素環置換低級アルキル基を示す。R⁸ は、上記複素環上に置換し、R⁸ は、水素原子、オキソ基、置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基、ハロゲン原子、ニトロ基、低級アルコキシ基、シアノ基、低級アルコキシカルボニル基、フェニル環上に置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基、カルボキシ置換低級アルコキシ基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基、水酸基、低級アルコキシ置換低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、低級アルカノイル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ置換低級アルコキシ基、水酸基、ハロゲン原子及び低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基、低級アルケニル基、モルホリノカルボニル低級アルコキシ基、低級アルキルスルフィニル基、置換基として低級アルキルスルホニル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基置換低級アルキル基、低級アルキルチオ基、低級アルキルスルホニル基、低級アルカノイルオキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのある1, 3-ジオキサニル置換低級アルキル基、低級アルカノイル基置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル置換低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基置換低級アルケニル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル置換低級アルケニル基、カルボキシ基置換低級アルケニル基、ベンゾイル基、低級アルコキシ低級アルキル基、基

【化6】



(式中sは1～3の整数を示す。)

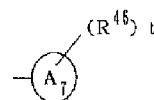
【化7】



は、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子なる群より選ばれたヘテロ原子を1～4個有する5～6員環の飽和又は不飽和複素環置換低級アルキル基を示す。R⁴⁵は上記複素環上に置換し、R⁴⁵は水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシ低級アルキル基、フェニル基又はオキソ基を示す。)

たヘテロ原子を1～4個有する5～6員環の飽和又は不飽和複素環置換低級アルキル基を示す。R⁴⁵は上記複素環上に置換し、R⁴⁵は水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシ低級アルキル基、フェニル基又はオキソ基を示す。)

【化8】



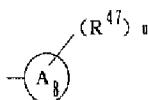
(式中tは1～3の整数を示す。)

【化9】



は、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子なる群より選ばれたヘテロ原子を1～4個有する5～6員環の飽和又は不飽和複素環置換低級アルキル基を示す。R⁴⁶は上記複素環上に置換し、R⁴⁶は水素原子、低級アルキル基又はオキソ基を示す。)、又は、基-(C=O)1NR⁹R¹⁰(ここで1は0又は1を示す。R⁹及びR¹⁰は同一又は異なって、水素原子、低級アルカノイル基、低級アルキル基、モルホリノカルボニル低級アルキル基、シクロアルキルカルボニル基、フェニル低級アルケニルカルボニル基、低級アルキルスルホニル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニルスルホニル基、フェニル低級アルケニル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基及び水酸基なる群より選ばれた基を1～3個有することのあるベンゾイル基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基置換低級アルカノイル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基置換スルホニル基、フェニル低級アルキル基、フェニル基又は置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を示す。またR⁹及びR¹⁰は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5又は6員環の飽和複素環を形成してもよい。)を示す。); x) 基-A₅-CR⁴²R⁴³R⁴⁴(式中A₅は低級アルキレン基を示す。R⁴²及びR⁴³は一緒になって基=O、基=N-OH又は低級アルキレンジオキシ基を形成するものとする。R⁴⁴はフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニル基を示す。); y) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキソ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基; 又は z) 基

【化10】



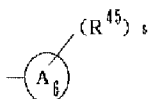
(式中uは1～3の整数を示す。)

【化11】



は、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子なる群より選ばれたヘテロ原子を1～4個有する5～14員の単環、二項環又は三項環の飽和又は不飽和複素環置換低級アルケニル基を示す。R⁴⁷は上記複素環上に置換し、R⁴⁷は水素原子、ハロゲン原子置換低級アルキル基、オキシ基、ハロゲン原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、カルボキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基又は基

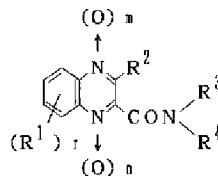
【化12】



(式中A_b、R⁴⁵及びsは前記に同じ。)を示す。)を示す。またA) R³及びR⁴は、これらが結合する窒素原子と共に結合して、1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル基を形成してもよい。該複素環には置換基として低級アルコキシ基を有していてもよい。但し、R¹が水素原子、R²がメチル基、R³が水素原子を示し、mが0を示す場合、R⁴は2-(イミダゾリル-2-イル)エチル基、2-(インドリル-3-イル)エチル基又はsec-ブチル基であってはならない。)で表わされるキノキサリン誘導体又はその塩。

【請求項2】 一般式

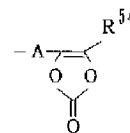
【化13】



(式中R¹は水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基を示す。R²は水素原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、フェニル基、モルホリノ置換低級アルキル基又はイミダゾリル置換低級アルキル基を示す。n及びmはそれぞれ0又は1を示す。rは1又は2を示す。R³及びR⁴は同一又は異なって、それぞれ

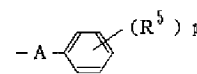
a) 水素原子; b) 低級アルキル基; c) フェニル低級アルコキシカルボニル基; d) 低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基; e) 低級アルカノイル基; f) 低級アルコキシカルボニル基; g) 低級アルコキシ低級アルキル基; h) フェノキシカルボニル基; i) 低級アルカノイル基置換低級アルキル基; j) 低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基; k) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基; l) 基-E-R⁵²R⁵³(R⁵²及びR⁵³は、同一又は異なって水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基又はフェニル基を示す。R⁵²及びR⁵³は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5員又は6員環の飽和複素環を形成してもよい。Eは低級アルキレン基、基-C(=O)-又は基-C(=O)-A-(Aは低級アルキレン基)を示す。); m) 基

【化14】



(式中Aは前記に同じ。R⁵⁴は水素原子又は低級アルキル基を示す。); n) 基

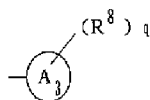
【化15】



(式中Aは低級アルキレン基を示す。pは1～3の整数を示す。R⁵は水素原子、低級アルコキシ置換低級アルコキシ基、低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、ハロゲン原子、ニトロ基、水酸基、置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基、低級アルケニルオキシ基、カルボキシ置換低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、水酸基置換低級アルコキシ基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及び低級アルコキシ基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのある1, 3-ジオキサソニル基、低級アルカノイル基、モルホリノ置換低級アルコキシ基、モルホリノ置換低級アルキル基、モルホリノカルボニル基又は、基-Y-A₁-CONR⁶R⁷(ここでA₁は低級アルキレン基、Yは基-O-又は基-NH-を示す。R⁶及びR⁷は同一又は異なって、水素原子、置換基として水酸基を有することのある低級アルキル

基、フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基、フリル置換低級アルキル基又は低級アルコキシ置換低級アルキル基を示す。また R^6 と R^7 とは、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく5又は6員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環には、置換基として水酸基、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基を1～3個有してもよい。)を示す。); o) フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基 $-O-A_4-CO-NR^{40}R^{41}$ (A_4 は低級アルキレン基を示す。 R^{40} 及び R^{41} は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。また R^{40} 及び R^{41} は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5員又は6員の飽和複素環を形成してもよい。)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基; p) アルケニル基; q) シクロアルキル低級アルキル基; r) ナフチル低級アルキル基; s) フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基; t) フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基; u) フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基; v) フェノキシ置換低級アルキル基; w) 基

【化16】



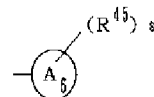
(式中qは1～3の整数を示す。
【化17】



は、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子なる群より選ばれたヘテロ原子を1～4個有する5～14員環の単環、二項環又は三項環の飽和又は不飽和複素環置換低級アルキル基を示す。 R^8 は、上記複素環上に置換し、 R^8 は、水素原子、オキソ基、置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基、ハロゲン原子、ニトロ基、低級アルコキシ基、シアノ基、低級アルコキシカルボニル基、フェニル環上に置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を有することのあるフェニル

低級アルコキシ基、カルボキシ置換低級アルコキシ基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基、水酸基、低級アルコキシ置換低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、低級アルカノイル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ置換低級アルコキシ基、水酸基、ハロゲン原子及び低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基、低級アルケニル基、モルホリノカルボニル低級アルコキシ基、低級アルキルスルフィニル基、置換基として低級アルキルスルホニル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基置換低級アルキル基、低級アルキルチオ基、低級アルキルスルホニル基、低級アルカノイルオキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのある1,3-ジオキサニル置換低級アルキル基、低級アルカノイル基置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル置換低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルケニル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル置換低級アルケニル基、カルボキシ基置換低級アルケニル基、ベンゾイル基、低級アルコキシ低級アルキル基、基

【化18】

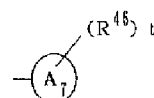


(式中sは1～3の整数を示す。
【化19】



は、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子なる群より選ばれたヘテロ原子を1～4個有する5～6員環の飽和又は不飽和複素環基を示す。 R^{45} は上記複素環上に置換し、 R^{45} は水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシ低級アルキル基、フェニル基又はオキソ基を示す。)、基

【化20】



(式中tは1～3の整数を示す。
【化21】

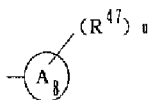


は、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子なる群より選ばれたヘテロ原子を1～4個有する5～6員環の飽和又は不飽和複素環置換低級アルキル基を示す。 R^{46} は上記複素環上に置換し、 R^{46} は水素原子、低級アルキル基又はオ

キソ基を示す。)

、又は、基—(C=O)NR⁹R¹⁰(ここで1は0又は1を示す。R⁹及びR¹⁰は同一又は異なって、水素原子、低級アルカノイル基、低級アルキル基、モルホリノカルボニル低級アルキル基、シクロアルキルカルボニル基、フェニル低級アルケニルカルボニル基、低級アルキルスルホニル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニルスルホニル基、フェニル低級アルケニル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基及び水酸基なる群より選ばれた基を1〜3個有することのあるベンゾイル基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基置換低級アルカノイル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基置換スルホニル基、フェニル低級アルキル基、フェニル基又は置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を示す。またR⁹及びR¹⁰は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5又は6員環の飽和複素環を形成してもよい。)を示す。); x) 基—A₆—CR⁴²R⁴³R⁴⁴(式中A₆は低級アルキレン基を示す。R⁴²及びR⁴³は一緒になって基=O、基=N—OH又は低級アルキレンジオキシ基を形成するものとする。R⁴⁴はフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニル基を示す。); y) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキシ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基; 又は z) 基

【化22】



(式中uは1〜3の整数を示す。)

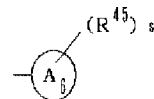
【化23】



は、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子なる群より選ばれたヘテロ原子を1〜4個有する5〜14員の単環、二項環又は三項環の飽和又は不飽和複素環置換低級アルケニル基を示す。R⁴⁷は上記複素環上に置換し、R⁴⁷は水素原子、ハロゲン原子置換低級アルキル基、オキシ基、ハロゲン原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、カルボキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあ

るアミノ基、フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基又は基

【化24】



(式中A₆、R⁴⁵及びsは前記に同じ。)を示す。)を示す。またA) R³及びR⁴は、これらが結合する窒素原子と共に結合して、1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル基を形成してもよい。該複素環には置換基として低級アルコキシ基を有していてもよい。)で表わされるキノキサリン誘導体及びその塩より選ばれた化合物の少なくとも1種を有効成分として含有する糖尿病治療剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

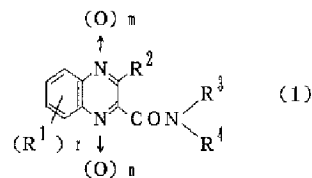
【産業上の利用分野】本発明は、糖尿病治療剤に関する。

【0002】

【発明の開示】本発明の糖尿病治療剤は、一般式

【0003】

【化25】

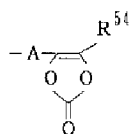


【0004】〔式中R¹は水素原子、ハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基を示す。R²は水素原子、置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基、フェニル基、モルホリノ置換低級アルキル基又はイミダゾリル置換低級アルキル基を示す。n及びmはそれぞれ0又は1を示す。rは1又は2を示す。R³及びR⁴は同一又は異なって、それぞれ a) 水素原子; b) 低級アルキル基; c) フェニル低級アルコキシカルボニル基; d) 低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基; e) 低級アルカノイル基; f) 低級アルコキシカルボニル基; g) 低級アルコキシ低級アルキル基; h) フェノキシカルボニル基; i) 低級アルカノイル基置換低級アルキル基; j) 低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基; k) フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基; l) 基—E—R⁵²R⁵³(R⁵²及びR⁵³は、同一又は異なって水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基又はフェ

ニル基を示す。R⁵²及びR⁵³は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5員又は6員環の飽和複素環を形成してもよい。Eは低級アルキレン基、基-C(=O)-又は基-C(=O)-A-(Aは低級アルキレン基)を示す。)； m) 基

【0005】

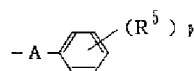
【化26】



【0006】(式中Aは前記に同じ。R⁵⁴は水素原子又は低級アルキル基を示す。)； n) 基

【0007】

【化27】

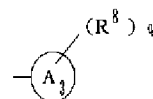


【0008】(式中Aは低級アルキレン基を示す。pは1～3の整数を示す。R⁵は水素原子、低級アルコキシ置換低級アルコキシ基、低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基、ハロゲン原子、ニトロ基、水酸基、置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基、低級アルケニルオキシ基、カルボキシ置換低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基、低級アルコキシカルボニル基、ハロゲン原子置換低級アルコキシ基、水酸基置換低級アルコキシ基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及び低級アルコキシ基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのある1, 3-ジオキサニル基、低級アルカノイル基、モルホリノ置換低級アルコキシ基、モルホリノ置換低級アルキル基、モルホリノカルボニル基又は、基-Y-A₁-CONR⁶R⁷(ここでA₁は低級アルキレン基、Yは基-O-又は基-NH-を示す。R⁶及びR⁷は同一又は異なって、水素原子、置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基、フリル置換低級アルキル基又は低級アルコキシ置換低級アルキル基を示す。またR⁶とR⁷とは、これらが結合する窒素原子と共に、窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく5又は6員環の飽和複素環を形成してもよい。該複素環には、置換基として水酸基、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基を1～3個有してもよい。)を示す。)； o) フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級

アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基-O-A₄-CO-NR⁴⁰R⁴¹(A₄は低級アルキレン基を示す。R⁴⁰及びR⁴¹は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。またR⁴⁰及びR⁴¹は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5員又は6員の飽和複素環を形成してもよい。)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基； p) アルケニル基； q) シクロアルキル低級アルキル基； r) ナフチル低級アルキル基； s) フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基； t) フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基； u) フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基； v) フェノキシ置換低級アルキル基； w) 基

【0009】

【化28】



【0010】(式中qは1～3の整数を示す。)

【0011】

【化29】

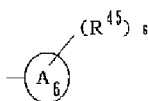


【0012】は、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子なる群より選ばれたヘテロ原子を1～4個有する5～14員環の単環、二項環又は三項環の飽和又は不飽和複素環置換低級アルキル基を示す。R⁸は、上記複素環上に置換し、R⁸は、水素原子、オキソ基、置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基、ハロゲン原子、ニトロ基、低級アルコキシ基、シアノ基、低級アルコキシカルボニル基、フェニル環上に置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基、カルボキシ置換低級アルコキシ基、カルボキシ基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルコキシ基、水酸基、低級アルコキシ置換低級アルコキシ基、低級アルケニルオキシ基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基、ハロゲン原子置換低級アルキル基、低級アルカノイル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ置換低級アルコキシ基、水酸基、ハロゲン原子及び低級アルコキシ基

なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基、低級アルケニル基、モルホリノカルボニル低級アルコキシ基、低級アルキルスルフィニル基、置換基として低級アルキルスルホニル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基置換低級アルキル基、低級アルキルチオ基、低級アルキルスルホニル基、低級アルカノイルオキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのある1, 3-ジオキサニル置換低級アルキル基、低級アルカノイル基置換低級アルキル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル置換低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基置換低級アルケニル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル置換低級アルケニル基、カルボキシ基置換低級アルケニル基、ベンゾイル基、低級アルコキシ低級アルキル基、基

【0013】

【化30】



【0014】(式中sは1～3の整数を示す。

【0015】

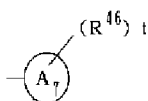
【化31】



【0016】は、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子なる群より選ばれたヘテロ原子を1～4個有する5～6員環の飽和又は不飽和複素環基を示す。R⁴⁵は上記複素環上に置換し、R⁴⁵は水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシ低級アルキル基、フェニル基又はオキシ基を示す。) 、基

【0017】

【化32】



【0018】(式中tは1～3の整数を示す。

【0019】

【化33】

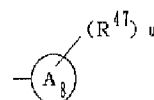


【0020】は、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子なる群より選ばれたヘテロ原子を1～4個有する5～6員環の飽和又は不飽和複素環置換低級アルキル基を示す。R⁴⁶は上記複素環上に置換し、R⁴⁶は水素原子、低級アルキル基又はオキシ基を示す。) 、又は、基-(C=O)NR⁹R¹⁰(ここで1は0又は1を示す。R⁹及びR¹⁰は同一又は異なって、水素原子、低級アルカノイル

基、低級アルキル基、モルホリノカルボニル低級アルキル基、シクロアルキルカルボニル基、フェニル低級アルケニルカルボニル基、低級アルキルスルホニル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニルスルホニル基、フェニル低級アルケニル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基及び水酸基なる群より選ばれた基を1～3個有することのあるベンゾイル基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基置換低級アルカノイル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基置換スルホニル基、フェニル低級アルキル基、フェニル基又は置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を示す。またR⁹及びR¹⁰は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5又は6員環の飽和複素環を形成してもよい。)を示す。) ; x) 基-A₅-CR⁴²R⁴³R⁴⁴(式中A₅は低級アルキレン基を示す。R⁴²及びR⁴³は一緒になって基=O、基=N-OH又は低級アルキレンジオキシ基を形成するものとする。R⁴⁴はフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニル基を示す。) ; y) 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキシ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基 ; 又は z) 基

【0021】

【化34】



【0022】(式中uは1～3の整数を示す。

【0023】

【化35】

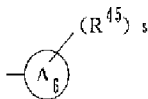


【0024】は、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子なる群より選ばれたヘテロ原子を1～4個有する5～14員の単環、二項環又は三項環の飽和又は不飽和複素環置換低級アルケニル基を示す。R⁴⁷は上記複素環上に置換し、R⁴⁷は水素原子、ハロゲン原子置換低級アルキル基、オキシ基、ハロゲン原子、低級アルコキシ基、低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基、カルボキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基、フェニル環上に置換基とし

て低級アルコキシ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基又は基

【0025】

【化36】



【0026】(式中 A_6 、 R^{45} 及び s は前記に同じ。)を示す。)を示す。また A 、 R^3 及び R^4 は、これらが結合する窒素原子と共に結合して、1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル基を形成してもよい。該複素環には置換基として低級アルコキシ基を有していてもよい。〕で表わされるキノキサリン誘導体及びその塩からなる群より選ばれた化合物の少なくとも1種を有効成分として含有するものである。

【0027】上記一般式(1)で表わされるキノキサリン誘導体及びその塩の内、 n が0である化合物の大部分は、文献未記載の新規化合物である。

【0028】糖尿病は、WHOの病型分類によれば、インスリンの絶対量の不足により急性又は亜急性に病状が現れ、インスリン治療を必要とするインスリン依存性糖尿病(insulin dependent diabetes mellitus, IDDM)、糖尿病の進行が緩慢で必ずしもインスリン治療を必要としないインスリン非依存性糖尿病(non insulin dependent diabetes mellitus, NIDDM)、栄養不良関連性糖尿病(malnutrition-related diabetes mellitus, MRDM)及びその他の疾患、病態に付随する慢性高血糖状態とに分類される。

【0029】このうちIDDMの成因としては、自己免疫機序による膵 β 細胞の崩壊に起因するとされている。膵 β 細胞の崩壊の原因としてはHLA抗原、サイトカインウィルスの関与等が考えられている(中西幸二、小林哲郎、原満:“糖尿病学1989”、小坂樹徳、赤沼安夫編集、診断と治療社、1989年、226~244頁)。一方NIDDMの成因としては、(i)膵臓に先天的な異常、即ち、インスリン需要の増大に対する適応能の異常、(ii)加齢、肥満、ストレス等種々の要因によって起こるインスリン作用障害等が存在すると考えられている(井村裕夫:“糖尿病学の進歩1989”、第23集、日本糖尿病学会編、診断と治療社、1989年、1~12頁)。

【0030】しかし、糖尿病の発症は、IDDM、NIDDMを含めて、遺伝要因と環境要因とが複雑に絡み合っており、尚未知の部分がかなり残されている。

【0031】ここでNIDDMにおいて、組織を見た場合、高血糖の原因の重要なものとしては、末梢組織、特に筋肉組織での糖の取り込みの低下と、肝臓での糖放出

の亢進の二つが考えられている。現在最も一般的に行なわれている薬物療法は、インスリン乃至スルホニルウレア剤(インスリン分泌促進剤)であり、いずれも不足しているインスリンを補うことを基本としているが、厳密な血糖コントロールは困難であるし、高インスリン血漿や、低血糖を引き起こす恐れがある。従って、インスリン分泌を促進することなく筋肉組織での糖の取り込みを促進する化合物は、高インスリン血漿や、低血糖の虞のない新しいタイプの血糖低下剤となり、糖尿病治療薬として有用であると考えられる。

【0032】上記一般式(1)で表わされるキノキサリン誘導体及びその塩(以下「本発明化合物」という)は、ラットの横紋筋(筋肉細胞)のセルラインであるL6細胞に対する2-デオキシグルコース(2DG)の取り込みを促進し、グルコースの消費も促進し、血糖低下作用を示す。また筋肉組織での糖の取り込みを促進する。特に本発明化合物は、糖尿病病態モデル動物であるdb/dbマウスやKK-Ayマウス(L. Herberg, D. L. Coleman; Metabolism, 第26巻, 第1号(1月)1977年, 第59~99頁)等に対して血糖低下作用を示す。また、本発明化合物は、インスリン分泌や、肝臓での糖放出に作用しないことから、急激な血糖低下作用はなく、OGTT(oral glucose tolerance test)にも殆ど影響しない望ましい特徴を有している。

【0033】従って、本発明の糖尿病治療剤は、糖尿病及び糖尿病性血管障害、糖尿病性網膜症、糖尿病性腎症、糖尿病性ノイロパチー等の糖尿病性合併症等の治療薬として有用である。

【0034】上記一般式(1)で示される各基は、より具体的にはそれぞれ以下の通りである。

【0035】低級アルキル基としては、例えばメチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、tert-ブチル、ペンチル、ヘキシル基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を挙げることができる。

【0036】ハロゲン原子としては、例えば弗素原子、塩素原子、臭素原子及び沃素原子等が挙げられる。

【0037】置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基としては、例えば前記低級アルキル基に加えて、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロメチル、ブロモメチル、フルオロメチル、ヨードメチル、ジフルオロメチル、ジブロモメチル、2-クロロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、3-クロロプロピル、2, 3-ジクロロプロピル、4, 4, 4-トリクロロブチル、4-フルオロブチル、5-クロロペンチル、3-クロロ-2-メチルプロピル、5-ブロモヘキシル、5, 6-ジクロロヘキシル、5-ブロモヘキシル、5, 6-ジクロロヘキシル基等の置換基としてハロゲン原子を1~3個有することのある炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アル

キル基を例示できる。

【0038】モルホリノ置換低級アルキル基としては、例えばモルホリノメチル、2-モルホリノエチル、1-モルホリノエチル、3-(2-モルホリニル)プロピル、4-(3-モルホリニル)ブチル、1,1-ジメチル-2-(2-モルホリニル)エチル、5-モルホリノペンチル、6-モルホリノヘキシル、2-メチル-3-モルホリノプロピル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるモルホリノ置換アルキル基を例示できる。

【0039】イミダゾリル置換低級アルキル基としては、例えば(1-イミダゾリル)メチル、2-(1-イミダゾリル)エチル、1-(2-イミダゾリル)エチル、3-(4-イミダゾリル)プロピル、4-(5-イミダゾリル)ブチル、1,1-ジメチル-2-(2-イミダゾリル)エチル、5-(4-イミダゾリル)ペンチル、6-(1-イミダゾリル)ヘキシル、2-メチル-3-(1-イミダゾリル)プロピル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるイミダゾリル置換アルキル基を例示できる。

【0040】低級アルキレン基としては、例えばメチレン、エチレン、トリメチレン、2-メチルトリメチレン、2,2-ジメチルトリメチレン、1-メチルトリメチレン、メチルメチレン、エチルメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキレン基を例示できる。

【0041】低級アルコキシ基としては、例えばメトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、tert-ブトキシ、ペンチルオキシ、ヘキシルオキシ基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を例示できる。

【0042】置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基としては、例えば、アミノ、メチルアミノ、エチルアミノ、プロピルアミノ、イソプロピルアミノ、ブチルアミノ、tert-ブチルアミノ、ペンチルアミノ、ヘキシルアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、ジプロピルアミノ、ジブチルアミノ、ジペンチルアミノ、ジヘキシルアミノ、N-メチル-N-エチルアミノ、N-エチル-N-プロピルアミノ、N-メチル-N-ブチルアミノ、N-メチル-N-ヘキシルアミノ基等の置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基を例示できる。

【0043】置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基としては、例えば前記低級アルキル基に加えて、ヒドロキシメチル、2-ヒドロキシエチル、1-ヒドロキシエチル、1-ヒドロキシイソプロピル、3-ヒドロキシプロピル、2,3-ジヒドロキシプロピル、4-ヒドロキシブチル、1,1-ジメチル-2-ヒドロキシエチル、5,5,4-トリヒドロキシペンチル、5

-ヒドロキシペンチル、6-ヒドロキシヘキシル、2-メチル-3-ヒドロキシプロピル、2,3-ジヒドロキシエチル、3,4-ジヒドロキシブチル、5,6-ジヒドロキシヘキシル基等の置換基として水酸基を1~3個有することのある炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0044】低級アルケニルオキシ基としては、例えばアリルオキシ、2-ブテニルオキシ、3-ブテニルオキシ、1-メチルアリルオキシ、2-ペンテニルオキシ、2-ヘキセニルオキシ基等の炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルケニルオキシ基を挙げることができる。

【0045】カルボキシ基置換低級アルコキシ基としては、例えば、カルボキシメトキシ、2-カルボキシエトキシ、1-カルボキシエトキシ、3-カルボキシプロポキシ、4-カルボキシブトキシ、5-カルボキシペンチルオキシ、6-カルボキシヘキシルオキシ、1,1-ジメチル-2-カルボキシエトキシ、2-メチル-3-カルボキシプロポキシ基等のアルコキシ部分の炭素数が1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるカルボキシアルコキシ基を挙げることができる。

【0046】低級アルコキシカルボニル基置換低級アルコキシ基としては、例えばメトキシカルボニルメトキシ、3-メトキシカルボニルプロポキシ、エトキシカルボニルメトキシ、3-エトキシカルボニルプロポキシ、4-エトキシカルボニルブトキシ、5-イソプロポキシカルボニルペンチルオキシ、6-プロポキシカルボニルヘキシルオキシ、1,1-ジメチル-2-ブトキシカルボニルエトキシ、2-メチル-3-tert-ブトキシカルボニルプロポキシ、2-ペンチルオキシカルボニルエトキシ、ヘキシルオキシカルボニルメトキシ基等のアルコキシカルボニル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基である炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルアルコキシ基を挙げることができる。

【0047】低級アルコキシカルボニル基としては、例えばメトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、tert-ブトキシカルボニル、ペンチルオキシカルボニル、ヘキシルオキシカルボニル基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基を例示できる。

【0048】ハロゲン原子置換低級アルコキシ基としては、例えば、トリフルオロメトキシ、トリクロロメトキシ、クロロメトキシ、ブromoメトキシ、フルオロメトキシ、ヨードメトキシ、ジフルオロメトキシ、ジブromoメトキシ、2-クロロエトキシ、2,2,2-トリフルオロエトキシ、2,2,2-トリクロロエトキシ、3-クロロプロポキシ、2,3-ジクロロプロポキシ、4,4,4-トリクロロブトキシ、4-フルオロブトキシ、5-クロロペンチルオキシ、3-クロロ-2-メチルプ

ロボキシ、5-ブロモヘキシルオキシ、5, 6-ジクロロヘキシルオキシ、5-ブロモヘキシルオキシ、5, 6-ジクロロヘキシルオキシ等の置換基としてハロゲン原子を1~3個有する炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を例示できる。

【0049】ヒドロキシ置換低級アルコキシ基としては、例えば、ヒドロキシメトキシ、2-ヒドロキシエトキシ、1-ヒドロキシエトキシ、1-ヒドロキシプロボキシ、3-ヒドロキシプロボキシ、2, 3-ジヒドロキシプロボキシ、4-ヒドロキシプロボキシ、1, 1-ジメチル-2-ヒドロキシエトキシ、5, 5, 4-トリヒドロキシペンチルオキシ、5-ヒドロキシペンチルオキシ、6-ヒドロキシヘキシルオキシ、1-ヒドロキシイソプロボキシ、2-メチル-3-ヒドロキシプロボキシ、2, 3-ジヒドロキシエトキシ、3, 4-ジヒドロキシプロボキシ、5, 6-ジヒドロキシヘキシルオキシ等の置換基として水酸基を1~3個有する炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を例示できる。

【0050】フェニル環上に置換基として低級アルキル基及び低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基としては、例えばベンジルオキシ、2-フェニルエトキシ、1-フェニルエトキシ、3-フェニルプロボキシ、4-フェニルプロボキシ、1, 1-ジメチル-2-フェニルエトキシ、5-フェニルペンチルオキシ、6-フェニルヘキシルオキシ、2-メチル-3-フェニルプロボキシ、2-(3-メトキシフェニル)エトキシ、1-(4-メトキシフェニル)エトキシ、2-メトキシベンジルオキシ、3-(2-エトキシフェニル)プロボキシ、4-(3-エトキシフェニル)プロボキシ、1, 1-ジメチル-2-(4-エトキシフェニル)エトキシ、5-(4-イソプロボキシフェニル)ペンチルオキシ、6-(4-ヘキシルオキシフェニル)ヘキシルオキシ、3, 4-ジメトキシベンジルオキシ、3, 4, 5-トリメトキシベンジルオキシ、2, 5-ジメトキシベンジルオキシ、3-メトキシベンジルオキシ、4-メトキシベンジルオキシ、2, 4-ジエトキシベンジルオキシ、2, 3-ジメトキシベンジルオキシ、2, 4-ジメトキシベンジルオキシ、2, 6-ジメトキシベンジルオキシ、2-メチルベンジルオキシ、4-エチルベンジルオキシ、2-(3-メチルフェニル)エトキシ、1-(4-メチルフェニル)エトキシ、3-(2-エチルフェニル)プロボキシ、4-(3-エチルフェニル)プロボキシ、1, 1-ジメチル-2-(4-エチルフェニル)エトキシ、5-(4-イソプロピルフェニル)ペンチルオキシ、6-(4-ヘキシルフェニル)ヘキシルオキシ、3, 4-ジメチルベンジルオキシ、3, 4, 5-トリメチルベンジルオキシ、2, 5-ジメチルベンジルオキシ、2-メトキシ-3-メチルベンジルオキシ等のアルコキシ部分の炭素数が1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であり、且つフェニル

環上に炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基及び炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群より選ばれた基を1~3個有することのあるフェニルアルコキシ基を挙げることができる。

【0051】置換基として低級アルキル基を有することのある1, 3-ジオキサニル基としては、例えば、1, 3-ジオキサニル、2-メチル-1, 3-ジオキサニル、4-エチル-1, 3-ジオキサニル、2-プロピル-1, 3-ジオキサニル、4-ブチル-1, 3-ジオキサニル、2-ペンチル-1, 3-ジオキサニル、4-ヘキシル-1, 3-ジオキサニル、2, 4-ジメチル-1, 3-ジオキサニル、2, 4, 5-トリメチル-1, 3-ジオキサニル等の置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~3個有することのある1, 3-ジオキサニル基を例示できる。

【0052】低級アルカノイル基としては、例えばホルミル、アセチル、プロピオニル、ブチリル、イソブチリル、ペンタノイル、tert-ブチルカルボニル、ヘキサノイル等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基が挙げられる。

【0053】モルホリノ置換低級アルコキシ基としては、例えば、モルホリノメトキシ、2-モルホリノエトキシ、1-モルホリノエトキシ、3-(2-モルホリニル)プロボキシ、4-(3-モルホリニル)プロボキシ、1, 1-ジメチル-2-(2-モルホリニル)エトキシ、5-モルホリノペンチルオキシ、6-モルホリノヘキシルオキシ、2-メチル-3-モルホリノプロボキシ等のアルコキシ部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるモルホリノ置換アルコキシ基を例示できる。

【0054】フェニル低級アルキル基としては、例えばベンジル、2-フェニルエチル、1-フェニルエチル、3-フェニルプロピル、4-フェニルブチル、5-フェニルペンチル、6-フェニルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-フェニルエチル、2-メチル-3-フェニルプロピル等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基を挙げることができる。

【0055】フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基としては、前記フェニル低級アルキル基に加えて、2-(3-メトキシフェニル)エチル、1-(4-メトキシフェニル)エチル、2-メトキシベンジル、3-メトキシベンジル、4-メトキシベンジル、3-(2-エトキシフェニル)プロピル、4-(3-エトキシフェニル)ブチル、1, 1-ジメチル-2-(4-エトキシフェニル)エチル、5-(4-イソプロボキシフェニル)ペンチル、6-(4-ヘキシルオキシフェニル)ヘキシル、3, 4-ジメトキシベンジル、2, 4-ジメトキシベン

ジル、3, 4, 5-トリメトキシベンジル基等のアルキル部分の炭素数が1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、且つフェニル環上に炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を1~3個有することのあるフェニルアルキル基を例示できる。

【0056】フリル置換低級アルキル基としては、例えば(2-フリル)メチル、2-(3-フリル)エチル、1-(2-フリル)エチル、3-(2-フリル)プロピル、4-(3-フリル)ブチル、5-(2-フリル)ペンチル、6-(3-フリル)ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-(2-フリル)エチル、2-メチル-3-(3-フリル)プロピル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフリル置換アルキル基を例示できる。

【0057】低級アルコキシ低級アルキル基としては、例えばメトキシメチル、2-エトキシエチル、1-メトキシエチル、3-メトキシプロピル、4-エトキシブチル、6-プロポキシヘキシル、5-イソプロポキシベンチル、1, 1-ジメチル-2-ブトキシエチル、2-メチル-3-tert-ブトキシプロピル、2-ペンチルオキシエチル、ヘキシルオキシメチル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシアルキル基を例示できる。

【0058】フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基-O-A₄-CO-NR⁴⁰R⁴¹(A₄、R⁴⁰及びR⁴¹は前記に同じ。)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基としては、例えばスチリル、シンナミル、4-フェニル-3-ブテニル、4-フェニル-2-ブテニル、5-フェニル-4-ペンテニル、5-フェニル-3-ペンテニル、5-フェニル-2-ペンテニル、6-フェニル-5-ヘキセニル、6-フェニル-4-ヘキセニル、6-フェニル-3-ヘキセニル、6-フェニル-2-ヘキセニル、β-メチル-4-フェニル-3-ブテニル、β-メチル-シンナミル、γ-メチル-シンナミル、5-フェニル-2, 4-ペンタジエニル、4-フェニル-1, 3-ブタジエニル、6-フェニル-2, 4-ヘキサジエニル、6-フェニル-3, 5-ヘキサジエニル、6-フェニル-1, 3-ヘキサジエニル、5-フェニル-1, 3-ペンタジエニル、3-メトキシシンナミル、4-メトキシシンナミル、2-メトキシシンナミル、4-メトキシスチリル、(2-エトキシフェニル)-2-ブテニル、5-(3-

エトキシフェニル)-4-ペンテニル、α, α-ジメチル-4-エトキシシンナミル、5-(4-イソプロポキシフェニル)-2, 4-ペンタジエニル、6-(4-ヘキシルオキシフェニル)-2-ヘキセニル、3, 4-ジメトキシシンナミル、3, 4, 5-トリメトキシスチリル、2, 5-ジメトキシスチリル、3-メトキシスチリル、4-メトキシスチリル、2, 4-ジエトキシスチリル、2, 3-ジメトキシシンナミル、2, 4-ジメトキシシンナミル、2, 6-ジメトキシシンナミル、2-ニトロシンナミル、3-ニトロシンナミル、4-ニトロシンナミル、4-(2-ニトロフェニル)-3-ブテニル、4-(3-ニトロフェニル)-2-ブテニル、5-(2-ニトロフェニル)-2-ペンテニル、6-(3-ニトロフェニル)-3-ヘキセニル、3, 4-ジニトロシンナミル、3, 4, 5-トリニトロシンナミル、2-ニトロスチリル、3-ニトロスチリル、4-ニトロスチリル、3-メチルシンナミル、2-メチルスチリル、4-メチルシンナミル、2-エチルシンナミル、4-イソプロピルシンナミル、4-(3-エチルフェニル)-3-ブテニル、α-メチル-4-イソプロピルシンナミル、5-(4-イソプロピルフェニル)-2-ペンテニル、6-(4-ヘキシルフェニル)-2-ヘキセニル、3, 4-ジメチルシンナミル、3, 4, 5-トリメチルシンナミル、2, 5-ジメチルシンナミル、2-クロロシンナミル、3-クロロスチリル、2-フルオロシンナミル、4-クロロシンナミル、2-フルオロスチリル、4-(3-フルオロフェニル)-2-ブテニル、5-(4-フルオロフェニル)-2-ペンテニル、α, α-ジメチル-2-ブロモシンナミル、6-(3-ブロモフェニル)-2-ヘキセニル、4-ブロモスチリル、2-ヨードフェニルシンナミル、3-ヨードスチリル、3, 4-ジクロロシンナミル、3, 5-ジクロロシンナミル、2, 6-ジクロロスチリル、2, 3-ジクロロシンナミル、2, 4-ジクロロスチリル、3, 4-ジフルオロシンナミル、3, 5-ジブロモシンナミル、3, 4, 5-トリクロロシンナミル、2-メトキシ-3-クロロシンナミル、3-(4-アセチルアミノフェニル)-2-ブテニル、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-ブテニル、3-[4-(1-メチルテトラゾール-5-イル)フェニル]-2-ブテニル、3-(4-シンナモイルアミノフェニル)-2-ブテニル、3-(3-メトキシメトキシフェニル)-2-ブテニル、3-(2-メトキシフェニル)-2-ブテニル、3-(3-メトキシフェニル)-2-ブテニル、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-ブテニル、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-ブテニル、3-(3-アセチルアミノフェニル)-2-ブテニル、3-(3-ヒドロキシフェニル)-2-ブテニル、3-(3-モルホリノカルボニルメトキシフェニル)-2-ブテニル、3-(3-ジエチルアミノカルボニルメトキシフェニル)-

2-ブテニル、3-[3-(2-メチル-2-プロペニルオキシ)フェニル]-2-ブテニル、4-クロロメチルスチリル、3-ブロモメチルシンナミル、4-(2-ヨードメチルフェニル)-3-ブテニル、4-[4-(2, 2, 2-トリクロロエチル)フェニル]-2-ブテニル、5-(4-アミノフェニル)-4-ペンテニル、5-(3-プロピオニルアミノフェニル)-2-ペンテニル、6-(2-ブチルアミノフェニル)-5-ヘキセニル、6-(4-ペンタノイルアミノフェニル)-4-ヘキセニル、6-(3-ヘキサノイルアミノフェニル)-3-ヘキセニル、6-(2, 4-ジアミノフェニル)-2-ヘキセニル、2, 4, 6-トリアミノシンナミル、4-(3-ブテノイルアミノ)スチリル、3-(2-ペンテノイルアミノ)シンナミル、4-[2-(4-ヘキセノイルアミノ)フェニル]-3-ブテニル、4-[4-(4-エトキシブトキシ)フェニル]-2-ブテニル、3-[4-(N-アセチル-N-シンナモイルアミノ)フェニル]-2-ブテニル、5-[2-(6-プロポキシヘキシルオキシ)フェニル]-4-ペンテニル、5-[3-(2-ベンチルオキシエトキシ)フェニル]-2-ペンテニル、6-(4-ヘキシルオキシメトキシフェニル)-5-ヘキセニル、6-[2-(1, 1-ジメチル-2-ブトキシエトキシ)フェニル]-3-ヘキセニル、3-(2, 4-ジメトキシメトキシフェニル)-2-ブテニル、3-(2, 4, 6-トリメトキシメトキシフェニル)-2-ブテニル、3-[4-(1-エチルテトラゾール-5-イル)フェニル]-2-ブテニル、3-[3-(2-プロピルテトラゾール-5-イル)フェニル]-2-ブテニル、3-[2-(1-ブチルテトラゾール-5-イル)フェニル]-2-ブテニル、3-[4-(2-ベンチルテトラゾール-5-イル)フェニル]-2-ブテニル、3-[3-(1-ヘキシルテトラゾール-5-イル)フェニル]-2-ブテニル、2-ヒドロキシシンナミル、3-ヒドロキシシンナミル、4-ヒドロキシシンナミル、4-(2-ヒドロキシフェニル)-3-ブテニル、5-(2-ヒドロキシフェニル)-2-ペンテニル、6-(3-ヒドロキシフェニル)-3-ヘキセニル、2, 4-ジヒドロキシシンナミル、3, 4, 5-トリヒドロキシシンナミル、4-ヒドロキシスチリル、4-アリルオキシスチリル、3-(2-ブテニルオキシ)シンナミル、4-[2-(3-ブテニルオキシ)フェニル]-3-ブテニル、5-[3-(2-ペンテニルオキシ)フェニル]-2-ペンテニル、6-[4-(2-ヘキセニルオキシ)フェニル]-4-ヘキセニル、2, 4-ジアリルオキシシンナミル、2, 4, 6-トリアリルオキシスチリル、3-(2-ジメチルアミノカルボニルエトキシフェニル)-2-ブテニル、4-[4-(3-ブチルアミノカルボニルプロポキシ)フェニル]-3-ブテニル、5-[2-(4-ベンチルアミノカルボニルブトキ

シ)フェニル]-3-ペンテニル、6-[3-(5-ヘキシルアミノカルボニルベンチルオキシ)フェニル]-5-ヘキセニル、4-[6-(N-メチル-N-プロピルアミノ)カルボニルヘキシルオキシ]スチリル、4-メチルアミノカルボニルメトキシシンナミル、4-(1-ピペリジニル)カルボニルメトキシシンナミル、3-(1-ピペラジニル)カルボニルメトキシスチリル、4-[3-(1-ピロリジニル)カルボニルメトキシフェニル]-3-ブテニル、3-(2-メトキシ-5-クロロフェニル)-2-ブテニル、3-(2-メトキシメトキシ-5-クロロフェニル)-2-ブテニル、3-(2-ヒドロキシ-5-クロロフェニル)-2-ブテニル基等のアルケニル部分の炭素数が2~6の直鎖又は分枝鎖状の二重結合を1~2個有するアルケニル基であり、且つフェニル環上に炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基及びアルケニルカルボニル部分が炭素数3~6の直鎖又は分枝鎖状アルケニルカルボニル基であるフェニルアルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を1~2個有することのあるアミノ基、炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基置換炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基-O-A₄-CO-NR⁴⁰R⁴¹(A₄は炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキレン基を示す。R⁴⁰及びR⁴¹は同一又は異なって水素原子又は炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を示す。またR⁴⁰及びR⁴¹は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5員又は6員の飽和複素環を形成してもよい。)、炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を1~3個有することのある炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基なる群より選ばれた基を1~3個有することのあるフェニルアルケニル基を挙げることができる。

【0059】アルケニル基としては、例えばビニル、アリル、3-メチル-2-ブテニル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチルアリル、2-ペンテニル、2-ヘキセニル、1-ヘプテニル、1-オクテニル、1-ノネニル、1-デセニル、1-ウンデセニル、1-ドデセニル、2-ヘプテニル、3-ヘプテニル、2-メチル-4-ヘプテニル、2-メチル-5-ヘプテニル、4-メチル-2-ヘプテニル、3-メチル-1-ヘプテニル、1, 3-ヘプタジエニル、1, 4-ヘプタジエニル、1, 5-ヘプタジエニル、1, 6-ヘプタジエニル、2, 4-ヘプタジエニル、2-メチル-2, 4-ヘプタジエニル、2, 6-ジメチル-2, 4-ヘプタジエニル、2, 5-ジメチル-1, 3-ヘプタジエニル、2, 4, 6-トリメチル-2, 4-ヘプタジエニル、2-オ

クテニル、3-オクテニル、4-オクテニル、2-メチル-5-オクテニル、2-メチル-6-オクテニル、2-メチル-7-オクテニル、1, 3-オクタジエニル、1, 4-オクタジエニル、1, 5-オクタジエニル、1, 6-オクタジエニル、1, 7-オクタジエニル、2, 4-オクタジエニル、3, 7-オクタジエニル、4, 8-ジメチル-3, 7-オクタジエニル、2, 4, 6-トリメチル-3, 7-オクタジエニル、3, 4-ジメチル-2, 5-オクタジエニル、3, 7-ジメチル-2, 6-オクタジエニル、4, 8-ジメチル-2, 6-オクタジエニル、2-ノネニル、3-ノネニル、4-ノネニル、2-メチル-5-ノネニル、2-メチル-6-ノネニル、2-メチル-7-ノネニル、2-メチル-8-ノネニル、1, 3-ノナジエニル、1, 4-ノナジエニル、1, 5-ノナジエニル、1, 6-ノナジエニル、1, 7-ノナジエニル、1, 8-ノナジエニル、2, 4-ノナジエニル、3, 7-ノナジエニル、4, 8-ジメチル-3, 7-ノナジエニル、2, 4, 6-トリメチル-3, 7-ノナジエニル、3, 4-ジメチル-2, 5-ノナジエニル、4, 8-ジメチル-2, 6-ノナジエニル、2-デセニル、3-デセニル、4-デセニル、5-デセニル、2-メチル-6-デセニル、3-メチル-7-デセニル、4-メチル-8-デセニル、5-メチル-9-デセニル、1, 3-デカジエニル、1, 4-デカジエニル、1, 5-デカジエニル、1, 6-デカジエニル、1, 7-デカジエニル、1, 8-デカジエニル、1, 9-デカジエニル、2-メチル-2, 4-デカジエニル、3-メチル-2, 5-デカジエニル、4, 8-ジメチル-2, 6-デカジエニル、2, 4, 6-トリメチル-3, 7-デカジエニル、2, 9-ジメチル-3, 7-デカジエニル、2-ウンデセニル、3-ウンデセニル、4-ウンデセニル、5-ウンデセニル、2-メチル-6-ウンデセニル、3-メチル-7-ウンデセニル、4-メチル-8-ウンデセニル、5-メチル-9-ウンデセニル、2-メチル-10-ウンデセニル、1, 3-ウンデカジエニル、1, 4-ウンデカジエニル、1, 5-ウンデカジエニル、1, 6-ウンデカジエニル、1, 7-ウンデカジエニル、1, 8-ウンデカジエニル、1, 9-ウンデカジエニル、1, 10-ウンデカジエニル、2-メチル-2, 4-ウンデカジエニル、3-メチル-2, 5-ウンデカジエニル、4, 8-ジメチル-2, 6-ウンデカジエニル、2, 4, 6-トリメチル-3, 8-ウンデカジエニル、2, 9-ジメチル-3, 8-ウンデカジエニル、2-ドデセニル、3-ドデセニル、4-ドデセニル、5-ドデセニル、6-ドデセニル、2-メチル-7-ドデセニル、3-メチル-8-ドデセニル、4-メチル-9-ドデセニル、5-メチル-10-ドデセニル、6-メチル-11-ドデセニル、2-メチル-2, 4-ドデカジエニル、3-メチル-2, 5-ドデカジエニル、4, 8-ジメチル-2, 6-ドデカジエニル、2, 4, 6-トリメチル-2, 7-ドデカジエニル、2, 10-ジメチル-2, 8-ドデカジエニル、2, 5-ジメチル-3, 7-ドデカジエニル、4, 8, 12-トリメチル-3, 7, 11-ドデカトリエニル、1, 3, 5-ヘプタトリエニル、2, 4, 6-オクタトリエニル、1, 3, 6-ノナトリエニル、2, 6, 8-ドデカトリエニル、1, 5, 7-ウンデカトリエニル基等の炭素数2~12の直鎖又は分枝鎖の二重結合を1~3個有するアルケニル基を例示できる。

【0060】シクロアルキル低級アルキル基としては、例えば、シクロヘキシルメチル、2-シクロプロピルエチル、1-シクロブチルエチル、3-シクロペンチルプロピル、4-シクロヘキシルブチル、2, 2-ジメチル-3-シクロヘプチルプロピル、5-シクロオクチルペンチル、6-シクロヘキシルヘキシル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である炭素数3~8のシクロアルキルアルキル基を例示できる。

【0061】ナフチル低級アルキル基としては、例えば、 α -ナフチルメチル、 β -ナフチルメチル、2-(α -ナフチル)エチル、1-(β -ナフチル)エチル、3-(β -ナフチル)プロピル、4-(α -ナフチル)ブチル、2-メチル-3-(α -ナフチル)プロピル、5-(β -ナフチル)ペンチル、6-(α -ナフチル)ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-(β -ナフチル)エチル等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるナフチルアルキル基を例示できる。

【0062】フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基としては、例えば、フェニルチオメチル、2-フェニルチオエチル、1-フェニルチオエチル、3-フェニルチオプロピル、4-フェニルチオブチル、5-フェニルチオペンチル、6-フェニルチオヘキシル、1, 1-ジメチル-2-フェニルチオエチル、2-メチル-3-フェニルチオプロピル、(2-メトキシフェニルチオ)メチル、(3-メトキシフェニルチオ)メチル、2-(4-メトキシフェニルチオ)エチル、1-(2-エトキシフェニルチオ)エチル、3-(4-イソプロポキシフェニルチオ)プロピル、4-(3-ペンチルオキシフェニルチオ)ブチル、5-(4-ヘキシルオキシフェニルチオ)ペンチル、6-(2-ブチルオキシフェニルチオ)ヘキシル、(3, 4-ジメトキシフェニルチオ)メチル、(3-エトキシ-4-メトキシフェニルチオ)メチル、2-(2, 3-ジメトキシフェニルチオ)エチル、1-(2, 6-ジメトキシフェニルチオ)エチル、2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニルチオ)エチル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を1~3個有することのあるアルキル部分の炭素数が1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル

基であるフェニルチオアルキル基を例示できる。

【0063】フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基としては、例えば、フェニルスルフィニルメチル、2-フェニルスルフィニルエチル、1-フェニルスルフィニルエチル、3-フェニルスルフィニルプロピル、4-フェニルスルフィニルブチル、5-フェニルスルフィニルペンチル、6-フェニルスルフィニルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-フェニルスルフィニルエチル、2-メチル-3-フェニルスルフィニルプロピル、(2-メトキシフェニルスルフィニル)メチル、(3-メトキシフェニルスルフィニル)メチル、2-(4-メトキシフェニルスルフィニル)エチル、1-(2-エトキシフェニルスルフィニル)エチル、3-(4-イソプロポキシフェニルスルフィニル)プロピル、4-(3-ペンチルオキシフェニルスルフィニル)ブチル、5-(4-ヘキシルオキシフェニルスルフィニル)ペンチル、6-(2-ブチルオキシフェニルスルフィニル)ヘキシル、3, 4-ジメトキシフェニルスルフィニル)メチル、3-エトキシ-4-メトキシフェニルスルフィニル)メチル、2-(2, 3-ジメトキシフェニルスルフィニル)エチル、1-(2, 6-ジメトキシフェニルスルフィニル)エチル、2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニルスルフィニル)エチル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を1~3個有することのあるアルキル部分の炭素数が1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルスルフィニルアルキル基を例示できる。

【0064】フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基としては、例えば、フェニルスルホニルメチル、2-フェニルスルホニルエチル、1-フェニルスルホニルエチル、3-フェニルスルホニルプロピル、4-フェニルスルホニルブチル、5-フェニルスルホニルペンチル、6-フェニルスルホニルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-フェニルスルホニルエチル、2-メチル-3-フェニルスルホニルプロピル、(2-メトキシフェニルスルホニル)メチル、(3-メトキシフェニルスルホニル)メチル、2-(4-メトキシフェニルスルホニル)エチル、1-(2-エトキシフェニルスルホニル)エチル、3-(4-イソプロポキシフェニルスルホニル)プロピル、4-(3-ペンチルオキシフェニルスルホニル)ブチル、5-(4-ヘキシルオキシフェニルスルホニル)ペンチル、6-(2-ブチルオキシフェニルスルホニル)ヘキシル、3, 4-ジメトキシフェニルスルホニル)メチル、3-エトキシ-4-メトキシフェニルスルホニル)メチル、2-(2, 3-ジメトキシフェニルスルホニル)エチル、1-(2, 6-ジメトキシフェニルスルホニル)エチル、2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニルスルホニル)エチル基等のフェニル環上に置換

基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を1~3個有することのあるアルキル部分の炭素数が1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルスルホニルアルキル基を例示できる。

【0065】窒素原子、酸素原子及び硫黄原子なる群より選ばれたヘテロ原子を1~4個有する5~14員環の単環、二項環又は三項環の飽和又は不飽和複素環基としては、例えばピロリジン、ピペリジン、ピペラジン、モルホリン、ピリジン、チエニル、キノリル、1, 4-ジヒドロキノリル、ベンゾチアゾリル、ピラジニル、ピリミジル、ヒリダジニル、ピロリル、カルボスチリル、3, 4-ジヒドロカルボスチリル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル、インドリル、イソインドリル、インドリニル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾオキサゾリル、イミダゾリジニル、イソキノリル、キナゾリジニル、キノキサリニル、シンノニル、フタラジニル、クロマニル、イソインドリニル、イソクロマニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピラゾリジニル、2, 3-ジヒドロベンゾフリル、ペリヒドロベンゾフリル、ベンゾフリル、ベンゾチエニル、4H-クロメニル、1, 3, 4-オキサジアゾリル、1, 2, 4-トリアゾリル、1, 2, 3, 4-テトラゾリル、1, 3, 4-トリアゾリル、1, 2, 4-オキサジアゾリル、2, 3-ジヒドロベンゾフリル、ペリヒドロベンゾフリル、5-1H-インダゾリル、フリル、ピロリニル、ノリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、チアゾリジニル、1, 2, 3, 5-オキサチアジアゾリル、イソチアゾリル、ピラニル、ピラゾリジニル、キヌクリジニル、1, 4-ベンゾオキサジニル、3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾオキサジニル、1, 4-ベンゾチアジニル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノキサリニル、1, 3-ジチア-2, 4-ジヒドロナフタレニル、1, 4-ジチアナフタレニル、フロ〔3, 2-c〕ピリジニル、フロ〔2, 3-g〕キノリル、3, 4-ジヒドロフロ〔2, 3-g〕キノリル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロフロ〔2, 3-g〕キノリル、1, 4-ベンゾジオキサニル、1, 2, 4-トリアジニル、ナフト〔2, 1-b〕フリル、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジニル等を例示できる。

【0066】窒素原子、酸素原子及び硫黄原子なる群より選ばれたヘテロ原子を1~4個有する5~14員環の単環、二項環又は三項環の飽和又は不飽和複素環置換低級アルキル基としては、例えばピロリジニルメチル、2-ピペリジニルエチル、3-ピペラジニルプロピル、4-モルホリンブチル、(2-ピリジン)メチル、(3-ピリジン)メチル、(2-チエニル)メチル、(3-キノリル)メチル、5-(6-キノリル)ペンチル、6-(1, 4-ジヒドロ-2-キノリル)ヘキシル、(2-ベンゾチアゾリル)メチル、2-(3-ピラジニル)エチル、1-(2-ピリミジニル)エチル、3-(3-ピリ

ダジニル)プロピル、4-(2-ピロリル)ブチル、5-(3-カルボスチリル)ペンチル、6-(3, 4-ジヒドロカルボスチリル-6-イル)ヘキシル、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル-8-イル)メチル、(2-インドリル)メチル、(3-インドリル)メチル、2-(3-インドリル)エチル、(4-イソインドリル)メチル、2-(3-インドリニル)エチル、(2-ベンゾイミダゾリル)メチル、3-(5-ベンゾオキサゾリル)プロピル、4-(4-イミダゾリジニル)ブチル、5-(1-イソキノリル)ペンチル、6-(7-キナゾリジニル)ヘキシル、(8-キノキサリニル)メチル、1-(4-シンノリニル)エチル、3-(5-フタラジニル)プロピル、4-(6-クロマニル)ブチル、5-(4-イソインドリニル)ペンチル、6-(7-イソクロマニル)ヘキシル、(3-ピラゾリル)メチル、2-(2-イミダゾリル)エチル、3-(3-ピラゾリジニル)プロピル、(2-ベンゾフリル)メチル、(3-ベンゾフリル)メチル、4-(6-ベンゾフリル)ブチル、(2-ベンゾチエニル)メチル、(3-ベンゾチエニル)メチル、5-(5-ベンゾチエニル)ペンチル、〔6-(4H-クロメニル)〕メチル、(2, 3-ジヒドロ-2-ベンゾフリル)メチル、(2-ベルヒドロベンゾフリル)メチル、(5-1H-インダゾリル)メチル、チエニルメチル、1-(5-イソインドリニル)エチル、3-(2-イミダゾリニル)プロピル、4-(2-ピロリニル)ブチル、(2-フリル)メチル、(4-オキサゾリル)メチル、(5-オキサゾリル)メチル、5-(4-オキサゾリル)ペンチル、6-(3-イソオキサゾリル)ヘキシル、(4-チアゾリル)メチル、(2-チアゾリル)メチル、2-(3-イソチアゾリル)エチル、(2-ピラニル)メチル、3-(3-ピラゾリジニル)プロピル、4-(2-ピラゾリニル)ブチル、5-(2-キヌクリジニル)ペンチル、(6-1, 4-ベンゾオキサジニル)メチル、(3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾオキサジン-2-イル)メチル、(3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾオキサジン-2-イル)メチル、1, 4-ベンゾチアジン-5-イル)メチル、(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノキサリニル-6-イル)メチル、(1, 3-ジチア-2, 4-ジヒドロナフタレン-6-イル)メチル、(1, 4-ジチアナフタレン-7-イル)メチル、(5-チアゾリル)メチル、(1, 3, 4-オキサジアゾリン-5-イル)メチル、(1, 2, 4-トリアゾール-5-イル)メチル、(1, 2, 3, 4-テトラゾール-5-イル)メチル、(1, 3, 4-トリアゾール-5-イル)メチル、(1, 2, 4-オキサジアゾール-5-イル)メチル、(1, 2, 4-トリアジン-3-イル)メチル、(チアゾリジニン-5-イル)メチル、(1, 2, 3, 5-オキサチアジアゾリン-4-イル)メチル、(3-フリル)メチル、(2-フ

リル)メチル、(2-イミダゾリル)メチル、2-(5-チアゾリル)エチル、1-(1, 3, 4-オキサジアゾリン-2-イル)エチル、3-(1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)プロピル、4-(1, 2, 3, 4-テトラゾール-5-イル)ブチル、6-(1, 3, 4-トリアゾール-2-イル)ヘキシル、2-(1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル)エチル、1-(1, 2, 4-トリアジン-5-イル)エチル、3-(チアゾリジニン-2-イル)プロピル、4-(1, 2, 3, 5-オキサチアジアゾリン-4-イル)ブチル、5-(フロ〔3, 2-c〕ピリジン-2-イル)ペンチル、6-(フロ〔2, 3-g〕キノリン-7-イル)ヘキシル、(3, 4-ジヒドロフロ〔2, 3-g〕キノリン-8-イル)メチル、2-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロフロ〔2, 3-g〕キノリン-4-イル)エチル、(1, 4-ベンゾジオキサン-2-イル)メチル、1-(1, 4-ベンゾジオキサン-3-イル)エチル、(2, 3-ジヒドロベンゾフラン-2-イル)メチル、(ベルヒドロベンゾフラン-2-イル)メチル、ナフト〔2, 1-b〕フリルメチル、4-(ナフト〔2, 1-b〕フリル)ペンチル、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジルメチル、2-(イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジル)エチル、1-(イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジル)エチル基等のアルキル部分の炭素数が1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である前記複素環置換アルキル基を例示できる。

【0067】フェノキシ置換低級アルキル基としては、例えば、フェノキシメチル、2-フェノキシエチル、1-フェノキシエチル、3-フェノキシプロピル、4-フェノキシブチル、5-フェノキシペンチル、6-フェノキシヘキシル、1, 1-ジメチル-2-フェノキシエチル、2-メチル-3-フェノキシプロピル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェノキシアルキル基を挙げることができる。

【0068】フェニル環上に置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基としては、例えばベンジルオキシ、2-フェニルエトキシ、1-フェニルエトキシ、3-フェニルプロポキシ、4-フェニルブトキシ、5-フェニルペンチルオキシ、6-フェニルヘキシオキシ、1, 1-ジメチル-2-フェニルエトキシ、2-メチル-3-フェニルプロポキシ、4-アセチルアミノベンジルオキシ、2-(2-プロピオニルアミノフェニル)エトキシ、1-(3-ブチルアミノフェニル)エトキシ、3-(4-ペンタノイルアミノフェニル)プロポキシ、4-(3-tert-ブチルカルボニルアミノフェニル)ブトキシ、5-(4-ヘキサノイルアミノフェニル)ペンチルオキシ、6-(3, 4-ビスアセチルアミノフェニル)ヘキシルオキシ、3, 4, 5-トリアセチルアミノベンジルオキシ、2, 4-ビスアセチルアミノベンジルオキシ、4-アミノベンジルオキシ、2, 3-

ジアミノベンジルオキシ、2, 4, 6-トリアミノベンジルオキシ、2-(3-アミノフェニル)エトキシ、3-(2-アミノフェニル)プロポキシ等のアルコキシ部分の炭素数が1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であり、フェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を有することのあるアミノ基を1~3個有することのあるフェニルアルコキシ基を挙げることができる。

【0069】低級アルコキシ置換低級アルコキシ基としては、例えばメトキシメトキシ、3-メトキシプロポキシ、4-エトキシブトキシ、6-プロポキシヘキシルオキシ、5-イソプロポキシペンチルオキシ、1, 1-ジメチル-2-ブトキシエトキシ、2-メチル-3-tert-ブトキシプロポキシ、2-ペンチルオキシエトキシ、ヘキシルオキシメトキシ等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基置換炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を挙げることができる。

【0070】低級アルカノイルオキシ基置換低級アルキル基としては、例えばアセチルオキシメチル、2, 2-ジメチルプロピオニルオキシメチル、プロピオニルオキシメチル、2-プロピオニルオキシエチル、1-アセチルオキシエチル、1-ブチルオキシエチル、3-アセチルオキシプロピル、4-イソブチルオキシブチル、5-ペンタノイルオキシペンチル、6-tert-ブチルカルボニルオキシヘキシル、1, 1-ジメチル-2-ヘキサノイルオキシエチル、2-メチル-3-アセチルオキシプロピル等の炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイルオキシ基置換炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を挙げることができる。

【0071】ハロゲン原子置換低級アルキル基としては、例えば、トリフルオロメチル、トリクロロメチル、クロロメチル、プロモメチル、フルオロメチル、ヨードメチル、ジフルオロメチル、ジプロモメチル、2-クロロエチル、2, 2, 2-トリフルオロエチル、2, 2, 2-トリクロロエチル、3-クロロプロピル、2, 3-ジクロロプロピル、4, 4, 4-トリクロロブチル、4-フルオロブチル、5-クロロペンチル、3-クロロ-2-メチルプロピル、5-ブromoヘキシル、5, 6-ジクロロヘキシル、5-ブromoヘキシル、5, 6-ジクロロヘキシル等の置換基としてハロゲン原子を1~3個有する炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0072】テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基としては、例えば、テトラゾリル、1-メチルテトラゾリル、2-メチル-テトラゾリル、5-エチルテトラゾリル、5-プロピルテトラゾリル、1-ブチルテトラゾリル、2-ペンチルテトラゾリル、1-ヘキシルテトラゾリル等のテトラゾール環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を有することのあるテトラゾリル

基を例示できる。

【0073】フェニル環上に置換基として低級アルキル基、低級アルコキシ置換低級アルコキシ基、水酸基、ハロゲン原子及び低級アルコキシ基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基としては、例えばフェニル、2-メチルフェニル、3-メチルフェニル、4-メチルフェニル、2-エチルフェニル、3-エチルフェニル、4-エチルフェニル、3-イソプロピルフェニル、4-ヘキシルフェニル、3, 4-ジメチルフェニル、2, 5-ジメチルフェニル、3, 4, 5-トリメチルフェニル、2-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、2-エトキシフェニル、3-エトキシフェニル、4-エトキシフェニル、4-イソプロポキシフェニル、4-ペンチルオキシフェニル、2, 4-ジメトキシフェニル、4-ヘキシルオキシフェニル、3, 4-ジメトキシフェニル、3-エトキシ-4-メトキシフェニル、2, 3-ジメトキシフェニル、3, 4-ジエトキシフェニル、2, 5-ジメトキシフェニル、2, 6-ジメトキシフェニル、3, 5-ジメトキシフェニル、3, 4-ジペンチルオキシフェニル、3, 4, 5-トリメトキシフェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、2-ブromoフェニル、3-ブromoフェニル、4-ブromoフェニル、2-ヨードフェニル、3-ヨードフェニル、4-ヨードフェニル、3, 4-ジクロロフェニル、3, 5-ジクロロフェニル、2, 6-ジクロロフェニル、2, 3-ジクロロフェニル、2, 4-ジクロロフェニル、3, 4-ジフルオロフェニル、3, 5-ジブromoフェニル、3, 4, 5-トリクロロフェニル、2-メトキシ-5-クロロフェニル、3-クロロ-4-メトキシフェニル、3-メトキシ-5-ヨードフェニル、3, 4-ジメトキシ-5-ブromoフェニル、3, 5-ジヨード-4-メトキシフェニル、2-ヒドロキシ-5-クロロフェニル、2-メトキシメトキシ-5-クロロフェニル、2-ヒドロキシフェニル、3-ヒドロキシフェニル、4-ヒドロキシフェニル、2, 3-ジヒドロキシフェニル、3, 4-ジヒドロキシフェニル、3, 4, 5-トリヒドロキシフェニル、2-メトキシメトキシフェニル、3-(3-メトキシプロポキシ)フェニル、4-(4-エトキシブトキシ)フェニル、2-(6-プロポキシヘキシルオキシ)フェニル、3-(5-イソプロポキシペンチルオキシ)フェニル、4-(1, 1-ジメチル-2-ブトキシエトキシ)フェニル、2-(2-メチル-3-tert-ブトキシプロポキシ)フェニル、3-(2-ペンチルオキシエトキシ)フェニル、4-ヘキシルオキシメトキシフェニル、2, 3-ジメトキシメトキシフェニル、3, 4, 5-トリメトキシメトキシフェニル等のフェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基、炭素数1~6の直鎖又は

分枝鎖状アルコキシ基置換炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基、水酸基、ハロゲン原子及び炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基なる群より選ばれた基を1～3個有することのあるフェニル基を例示できる。

【0074】低級アルケニル基としては、例えばビニル、アリル、2-ブテニル、3-ブテニル、1-メチルアリル、2-ペンテニル、2-ヘキセニル基等の炭素数2～6の直鎖又は分枝鎖状アルケニル基を挙げることができる。

【0075】モルホリノカルボニル低級アルコキシ基としては、例えば、モルホリノカルボニルメトキシ、2-モルホリノカルボニルエトキシ、1-モルホリノカルボニルエトキシ、3-(2-モルホリニルカルボキシ)プロポキシ、4-(3-モルホリニルカルボニル)ブトキシ、1, 1-ジメチル-2-(2-モルホリニルカルボニル)エトキシ、5-モルホリノカルボニルペンチルオキシ、6-モルホリノカルボニルヘキシルオキシ、2-メチル-3-モルホリノカルボニルプロポキシ基等のアルコキシ部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基であるモルホリノカルボニルアルコキシ基を例示できる。

【0076】モルホリノカルボキシ低級アルキル基としては、例えば、モルホリノカルボニルメチル、2-モルホリノカルボニルエチル、1-モルホリノカルボニルエチル、3-(2-モルホリニルカルボニル)プロピル、4-(3-モルホリニルカルボニル)ブチル、1, 1-ジメチル-2-(2-モルホリニルカルボニル)エチル、5-モルホリノカルボニルペンチル、6-モルホリノカルボニルヘキシル、2-メチル-3-モルホリノカルボニルプロピル基等のアルキル部分が炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるモルホリノカルボニルアルキル基を例示できる。

【0077】シクロアルキルカルボニル基としては、例えばシクロプロピルカルボニル、シクロブチルカルボニル、シクロペンチルカルボニル、シクロヘキシルカルボニル、シクロヘプチルカルボニル、シクロオクチルカルボニル基等の炭素数3～8のシクロアルキルカルボニル基を例示できる。

【0078】フェニル低級アルケニルカルボニル基としては、例えば、シンナモイル、4-フェニル-3-ブテノイル、4-フェニル-2-ブテノイル、5-フェニル-4-ペンテノイル、5-フェニル-3-ペンテノイル、5-フェニル-2-ペンテノイル、6-フェニル-5-ヘキセノイル、6-フェニル-4-ヘキセノイル、6-フェニル-3-ヘキセノイル、6-フェニル-2-ヘキセノイル、2-メチル-4-フェニル-3-ブテノイル、2-メチル-シンナモイル、1-メチル-シンナモイル基等のアルケニルカルボニル基が炭素数3～6の直鎖又は分枝鎖状のアルケニルカルボニル基であるフェ

ニルアルケニルカルボニル基を例示できる。

【0079】 R^6 及び R^7 、 R^9 及び R^{10} 、 R^{40} 及び R^{41} 又は R^{52} 及び R^{53} が結合する窒素原子と共に窒素原子もしくは酸素原子を介して又は介することなく互いに結合して形成する5～6員の飽和複素環基としては、例えばピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、モルホリノ基等を例示できる。

【0080】水酸基、低級アルキル基及びフェニル低級アルキル基なる群より選ばれた基を1～3個有する上記複素環基としては、例えば、3-ヒドロキシピロリジニル、2-ヒドロキシピロリジニル、4-ヒドロキシピペリジニル、3-ヒドロキシピペリジニル、2-ヒドロキシピペリジニル、3-ヒドロキシピペラジニル、2-ヒドロキシピペラジニル、3-ヒドロキシモルホリノ、2-ヒドロキシモルホリノ、4-ベンジルピペラジニル、3-(2-フェニルエチル)ピロリジニル、2-(3-フェニルプロピル)ピロリジニル、4-(4-フェニルブチル)ピペリジニル、3-(5-フェニルペンチル)モルホリノ、2-(6-フェニルヘキシル)ピペラジニル、4-メチルピペラジニル、3, 4-ジメチルピペラジニル、3-エチルピロリジニル、2-アロピルピロリジニル、3, 4, 5-トリメチルピペリジニル、4-ブチルピペリジニル、3-ペンチルモルホリノ、2-ヘキシルピペラジニル、3-メチル-4-ベンジルピペラジニル、3-エチル-4-ヒドロキシピペリジニル、3-メチル-4-ベンジルピロリジニル基等の水酸基、炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基及びアルキル基部分の炭素数が1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基なる群より選ばれた基を1～3個有する上記複素環基を例示できる。

【0081】置換基として、低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基としては、例えば、アミノ、ホルミルアミノ、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ、イソブチリルアミノ、ペンタノイルアミノ、セブチルカルボニルアミノ、ヘキサノイルアミノ、シンナモイルアミノ、4-フェニル-3-ブテノイルアミノ、4-フェニル-2-ブテノイルアミノ、5-フェニル-4-ペンテノイルアミノ、5-フェニル-3-ペンテノイルアミノ、5-フェニル-2-ペンテノイルアミノ、6-フェニル-5-ヘキセノイルアミノ、6-フェニル-4-ヘキセノイルアミノ、6-フェニル-3-ヘキセノイルアミノ、6-フェニル-2-ヘキセノイルアミノ、2-メチル-4-フェニル-3-ブテノイルアミノ、2-メチル-シンナモイルアミノ、1-メチル-シンナモイルアミノ、N-アセチル-N-シンナモイルアミノ基等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基及びアルケニルカルボニル部分が炭素数3～6の直鎖又は分枝鎖状のアルケニルカルボニル基であるフェニルアルケニルカルボニル基

なる群より選ばれた基を1〜2個有することのあるアミノ基を例示できる。

【0082】置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基としては、例えば、アミノ、ホルミルアミノ、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ、イソブチリルアミノ、ペンタノイルアミノ、*tert*-ブチルカルボニルアミノ、ヘキサノイルアミノ基等の置換基として炭素数1〜6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を有することのあるアミノ基を例示できる。

【0083】低級アルキルスルフィニル基としては、例えばメチルスルフィニル、エチルスルフィニル、イソプロピルスルフィニル、ブチルスルフィニル、*tert*-ブチルスルフィニル、ペンチルスルフィニル、ヘキシルスルフィニル基等の炭素数1〜6の直鎖又は分枝鎖状アルキルスルフィニル基を例示できる。

【0084】低級アルキルチオ基としては、例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、*tert*-ブチルチオ、ペンチルチオ、ヘキシルチオ基等の炭素数1〜6の直鎖又は分枝鎖状アルキルチオ基を例示できる。

【0085】低級アルキルスルホニル基としては、例えばメチルスルホニル、エチルスルホニル、イソプロピルスルホニル、ブチルスルホニル、*tert*-ブチルスルホニル、ペンチルスルホニル、ヘキシルスルホニル基等の炭素数1〜6の直鎖又は分枝鎖状アルキルスルホニル基を例示できる。

【0086】低級アルカノイルオキシ基としては、例えば、ホルミルオキシ、アセチルオキシ、プロピオニルオキシ、ブチリルオキシ、イソブチリルオキシ、ペンタノイルオキシ、*tert*-ブチルカルボニルオキシ、ヘキサノイルオキシ基等の炭素数1〜6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイルオキシ基を例示できる。

【0087】置換基として低級アルキルスルホニル基及び低級アルカノイル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基置換低級アルキル基としては、例えば、アミノメチル、2-アミノエチル、1-アミノエチル、3-アミノプロピル、4-アミノブチル、5-アミノペンチル、6-アミノヘキシル、1, 1-ジメチル-2-アミノエチル、2-メチル-3-アミノプロピル、ホルミルアミノメチル、1-アセチルアミノエチル、2-プロピオニルアミノエチル、3-ブチリルアミノプロピル、4-ペンタノイルアミノペンチル、5-ヘキサノイルアミノヘキシル、6-イソブチリルアミノヘキシル、1, 1-ジメチル-2-アセチルアミノエチル、2-メチル-3-ホルミルアミノプロピル、メチルスルホニルアミノメチル、2-エチルスルホニルアミノエチル、1-イソプロピルスルホニルアミノエチル、3-ブチルスルホニルアミノプロピル、4-*tert*-ブチルスルホニルアミノブチル、5-ペンチルスルホニルアミ

ノペンチル、6-ヘキシルスルホニルアミノヘキシル、1, 1-ジメチル-2-メチルスルホニルアミノエチル、2-メチル-3-エチルスルホニルアミノプロピル、*N*-メチルスルホニルアミノ-*N*-アセチルアミノメチル基等の置換基として炭素数1〜6の直鎖又は分枝鎖状アルキルスルホニル基及び炭素数1〜6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基なる群より選ばれた基を1〜2個有することのあるアミノ基を有する炭素数1〜6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0088】置換基として低級アルキル基を有することのある1, 3-ジオキソフラン置換低級アルキル基としては、例えば、(1, 3-ジオキソラン-2-イル)メチル、2-(1, 3-ジオキソラン-4-イル)エチル、1-(1, 3-ジオキソラン-2-イル)エチル、3-(1, 3-ジオキソラン-4-イル)プロピル、4-(1, 3-ジオキソラン-2-イル)ブチル、2-(1, 3-ジオキソラン-2-イル)プロピル、5-(1, 3-ジオキソラン-2-イル)ペンチル、(4-ヘキシル-1, 3-ジオキソラン-2-イル)メチル、(2, 4-ジメチル-1, 3-ジオキソラン-2-イル)メチル、6-(1, 3-ジオキソラン-3-イル)ヘキシル、4-(2-プロピル-1, 3-ジオキソラン-2-イル)ブチル、5-(4-ブチル-1, 3-ジオキソラン-2-イル)ペンチル、6-(2-ペンチル-1, 3-ジオキソラン-2-イル)ヘキシル、1, 1-ジメチル-2-(1, 3-ジオキソラン-2-イル)エチル、2-メチル-3-(1, 3-ジオキソラン-2-イル)プロピル、(2-メチル-1, 3-ジオキソラン-2-イル)メチル、2-(4-エチル-1, 3-ジオキソラニル-2-イル)エチル、3-(2, 4, 5-トリメチル-1, 3-ジオキソラン-2-イル)プロピル基等のアルキル部分が炭素数1〜6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であり、置換基として炭素数1〜6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1〜3個有することのある1, 3-ジオキソラニル置換アルキル基を例示できる。

【0089】低級アルカノイル基置換低級アルキル基としては、例えば、ホルミルメチル、アセチルメチル、2-プロピオニルエチル、1-ブチリルエチル、3-イソブチリルプロピル、4-ペンタノイルブチル、5-ヘキサノイルヘキシル、6-*tert*-ブチルカルボニルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-アセチルエチル、2-メチル-3-アセチルメチル基等のアルカノイル部分が炭素数1〜6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基であり、アルキル部分が炭素数1〜6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるアルカノイルアルキル基を例示できる。

【0090】置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル置換低級アルキル基としては、例えば、アミノカルボニルメチル、2-アミノカルボニルエチル、1-アミノカルボニルエチル、3-アミノカルボニルプロピル、4-アミノカルボニルブチル、5-

アミノカルボニルペンチル、6-アミノカルボニルヘキシル、1, 1-ジメチル-2-アミノカルボニルエチル、2-メチル-3-アミノカルボニルプロピル、メチルアミノカルボニルメチル、1-エチルアミノカルボニルエチル、2-プロピルアミノカルボニルエチル、3-イソプロピルアミノカルボニルプロピル、4-ブチルアミノカルボニルブチル、5-ペンチルアミノカルボニルペンチル、6-ヘキシルアミノカルボニルヘキシル、ジメチルアミノカルボニルメチル、2-ジエチルアミノカルボニルエチル、2-ジメチルアミノカルボニルエチル、(N-エチル-N-プロピルアミノ)カルボニルメチル、2-(N-メチル-N-ヘキシルアミノ)カルボニルエチル基等の置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することのあるアミノカルボニル基を有する炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0091】低級アルコキシカルボニル基置換低級アルケニル基としては、例えば、2-メトキシカルボニルビニル、2-エトキシカルボニルビニル、3-プロポキシカルボニルアリル、4-ブトキシカルボニル-2-ブテニル、4-ペンチルオキシカルボニル-3-ブテニル、3-ヘキシルオキシカルボニル-1-メチルアリル、5-イソプロポキシカルボニル-2-ペンテニル、6-tert-ブトキシカルボニル-2-ヘキセニル基等のアルケニル部分が炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルケニル基である炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基置換アルケニル基を例示できる。

【0092】置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基置換低級アルケニル基としては、例えば、2-アミノカルボニルビニル、3-アミノカルボニルアリル、4-アミノカルボニル-2-ブテニル、4-アミノカルボニル-3-ブテニル、3-アミノカルボニル-1-メチルアリル、5-アミノカルボニル-2-ペンテニル、6-アミノカルボニル-2-ヘキセニル、2-メチルアミノカルボニルビニル、3-エチルアミノカルボニルアリル、4-プロピルアミノカルボニル-2-ブテニル、4-イソプロピルアミノカルボニル-3-ブテニル、3-ブチルアミノカルボニル-1-メチルアリル、5-ペンチルアミノカルボニル-2-ペンテニル、6-ヘキシルアミノカルボニル-2-ヘキセニル、2-ジメチルアミノカルボニルビニル、2-ジエチルアミノカルボニルビニル、3-(N-エチル-N-プロピルアミノカルボニル)アリル、4-(N-メチル-N-ヘキシルアミノカルボニル)-2-ブテニル基等の置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することのあるアミノカルボニル基が置換した炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルケニル基を例示できる。

【0093】カルボキシ基置換低級アルケニル基としては、例えば、2-カルボキシビニル、3-カルボキシア

リル、4-カルボキシ-2-ブテニル、4-カルボキシ-3-ブテニル、3-カルボキシ-1-メチルアリル、5-カルボキシ-2-ペンテニル、6-カルボキシ-2-ヘキセニル基等のカルボキシ基が置換した炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルケニル基を例示できる。

【0094】置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基としては、例えば、アミノカルボニル、メチルアミノカルボニル、エチルアミノカルボニル、プロピルアミノカルボニル、イソプロピルアミノカルボニル、ブチルアミノカルボニル、tert-ブチルアミノカルボニル、ペンチルアミノカルボニル、ヘキシルアミノカルボニル、ジメチルアミノカルボニル、ジエチルアミノカルボニル、ジプロピルアミノカルボニル、ジブチルアミノカルボニル、ジペンチルアミノカルボニル、ジヘキシルアミノカルボニル、N-メチル-N-エチルアミノカルボニル、N-エチル-N-プロピルアミノカルボニル、N-メチル-N-ブチルアミノカルボニル、N-メチル-N-ヘキシルアミノカルボニル基等の置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~2個有することのあるアミノカルボニル基を例示できる。

【0095】フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニルスルホニル基としては、例えば、フェニルスルホニル、2-メチルフェニルスルホニル、3-メチルフェニルスルホニル、4-メチルフェニルスルホニル、2-エチルフェニルスルホニル、3-エチルフェニルスルホニル、4-エチルフェニルスルホニル、3-イソプロピルフェニルスルホニル、4-ヘキシルフェニルスルホニル、3, 4-ジメチルフェニルスルホニル、2, 5-ジメチルフェニルスルホニル、3, 4, 5-トリメチルフェニルスルホニル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1~3個有することのあるフェニルスルホニル基を例示できる。

【0096】フェニル低級アルケニル基としては、例えば、スチリル、シンナミル、4-フェニル-3-ブテニル、4-フェニル-2-ブテニル、5-フェニル-4-ペンテニル、5-フェニル-3-ペンテニル、5-フェニル-2-ペンテニル、6-フェニル-5-ヘキセニル、6-フェニル-4-ヘキセニル、6-フェニル-3-ヘキセニル、6-フェニル-2-ヘキセニル、2-メチル-4-フェニル-3-ブテニル、2-メチル-シンナミル、1-メチル-シンナミル基等のアルケニル部分が炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状アルケニル基であるフェニルアルケニル基を例示できる。

【0097】フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイルを有することのあるアミノ基及び水酸基なる群から選ばれた基を1~3個有することのあるベンゾイル基としては、例えば、ベンゾイル、2-クロロベンゾイル、3-

クロロベンゾイル、4-クロロベンゾイル、2-フルオロベンゾイル、3-フルオロベンゾイル、4-フルオロベンゾイル、2-ブロモベンゾイル、3-ブロモベンゾイル、4-ブロモベンゾイル、2-ヨードベンゾイル、4-ヨードベンゾイル、3, 5-ジクロロベンゾイル、2, 6-ジクロロベンゾイル、3, 4-ジクロロベンゾイル、3, 4-ジフルオロベンゾイル、3, 5-ジブロモベンゾイル、3, 4, 5-トリクロロベンゾイル、2-メトキシベンゾイル、3-メトキシベンゾイル、4-メトキシベンゾイル、2-エトキシベンゾイル、3-エトキシベンゾイル、4-エトキシベンゾイル、4-イソプロポキシベンゾイル、4-ヘキシルオキシベンゾイル、3, 4-ジメトキシベンゾイル、3, 4-ジエトキシベンゾイル、3, 4, 5-トリメトキシベンゾイル、2, 5-ジメトキシベンゾイル、3-メトキシ-4-クロロベンゾイル、2-クロロ-6-メトキシベンゾイル、2-メトキシ-5-クロロベンゾイル、2-アミノベンゾイル、3-アミノベンゾイル、4-アミノベンゾイル、2-ヒドロキシベンゾイル、3-ヒドロキシベンゾイル、4-ヒドロキシベンゾイル、2, 5-ジアミノベンゾイル、3, 4, 5-トリアミノベンゾイル、2-ホルミルアミノベンゾイル、3-アセチルアミノベンゾイル、4-アセチルアミノベンゾイル、2-アセチルアミノベンゾイル、3-プロピオニルアミノベンゾイル、4-ブチルアミノベンゾイル、2-イソブチルアミノベンゾイル、3-ペンタノイルアミノベンゾイル、3-tert-ブチルカルボニルアミノベンゾイル、4-ヘキサノイルアミノベンゾイル、2, 6-ジアセチルアミノベンゾイル、2, 4-ジヒドロキシベンゾイル、2, 4, 6-トリヒドロキシベンゾイル、2-ヒドロキシ-5-クロロベンゾイル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状のアルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状のアルカノイル基を有することのあるアミノ基及び水酸基なる群から選ばれた基を1～3個を有することのあるベンゾイル基を例示できる。

【0098】置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基置換低級アルカノイル基としては、例えば、2-アミノアセチル、3-アミノプロピオニル、2-アミノプロピオニル、4-アミノブチリル、5-アミノペンタノイル、6-アミノヘキサノイル、2, 2-ジメチル-3-アミノプロピオニル、2-メチル-3-アミノプロピオニル、2-アセチルアミノアセチル、2-アセチルアミノプロピオニル、3-プロピオニルアミノプロピオニル、3-イソプロピオニルアミノプロピオニル、4-ブチルアミノブチリル、5-ペンタノイルアミノペンタノイル、6-ヘキサノイルアミノヘキサノイル、2-ホルミルアミノアセチル基等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を1～2個有することのあるアミノ基を有する炭素数2

～6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を例示できる。

【0099】置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ置換スルホニル基としては、例えば、アミノスルホニル、メチルアミノスルホニル、エチルアミノスルホニル、プロピルアミノスルホニル、イソプロピルアミノスルホニル、ブチルアミノスルホニル、tert-ブチルアミノスルホニル、ペンチルアミノスルホニル、ヘキシルアミノスルホニル、ジメチルアミノスルホニル、ジエチルアミノスルホニル、ジプロピルアミノスルホニル、ジブチルアミノスルホニル、ジペンチルアミノスルホニル、ジヘキシルアミノスルホニル、N-メチル-N-エチルアミノスルホニル、N-エチル-N-プロピルアミノスルホニル、N-メチル-N-ブチルアミノスルホニル、N-メチル-N-ヘキシルアミノスルホニル基等の置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を1～2個有することのあるアミノスルホニル基を例示できる。

【0100】低級アルケレンジオキシ基としては、例えば、メチレンジオキシ、エチレンジオキシ、トリメチレンジオキシ、テトラメチレンジオキシ基等の炭素数1～4の直鎖又は分枝鎖状アルケレンジオキシ基を例示できる。

【0101】フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニル基としては、例えば、フェニル、2-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、2-エトキシフェニル、3-エトキシフェニル、4-エトキシフェニル、4-イソプロポキシフェニル、4-ペンチルオキシフェニル、2, 4-ジメトキシフェニル、4-ヘキシルオキシフェニル、3, 4-ジメトキシフェニル、3-エトキシ-4-メトキシフェニル、2, 3-ジメトキシフェニル、3, 4-ジエトキシフェニル、2, 5-ジメトキシフェニル、2, 6-ジメトキシフェニル、3, 5-ジメトキシフェニル、3, 4-ジペンチルオキシフェニル、3, 4, 5-トリメトキシフェニル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1～6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基を1～3個有することのあるフェニル基を例示できる。

【0102】2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキシ基、水酸基、及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基としては、例えば、(2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イル)メチル、2-(2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-1-イル)エチル、1-(2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-3-イル)エチル、3-(2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-4-イル)プロピル、4-(2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-5-イル)ブチル、5-(2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-6-イル)ペンチル、6-

(2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-7-イル)ヘキシル、(1-オキソ-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イル)メチル、(1-ヒドロキシ-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イル)メチル、(1-ジメチル, tert-ブチルシリルオキシ-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イル)メチル、(1, 3-ジヒドロキシ-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イル)メチル、〔1, 3-ビス(トリメチルシリルオキシ)-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イル)メチル、(1, 3, 7-トリヒドロキシ-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イル)メチル、〔1, 3, 4-トリ(ジメチル, エチルシリルオキシ)-2, 3-ジヒドロ-1H-インデン-2-イル)メチル基等の2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキソ基、水酸基及び置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を3個有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を1~3個有することのある2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基が置換した炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を例示できる。

【0103】置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基としては、例えば、トリメチルシリルオキシ、トリエチルシリルオキシ、トリイソプロピルシリルオキシ、トリブチルシリルオキシ、トリtert-ブチルシリルオキシ、トリペンチルシリルオキシ、トリヘキシルシリルオキシ、ジメチル, tert-ブチルシリルオキシ基等の炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基が3個置換したシリルオキシ基を例示できる。

【0104】フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基としては、例えば、フェニル、2-メトキシフェニル、3-メトキシフェニル、4-メトキシフェニル、2-エトキシフェニル、3-エトキシフェニル、4-エトキシフェニル、4-イソプロポキシフェニル、4-ペンチルオキシフェニル、2, 4-ジメトキシフェニル、4-ヘキシルオキシフェニル、3, 4-ジメトキシフェニル、3-エトキシ-4-メトキシフェニル、2, 3-ジメトキシフェニル、3, 4-ジエトキシフェニル、2, 5-ジメトキシフェニル、2, 6-ジメトキシフェニル、3, 5-ジメトキシフェニル、3, 4-ジペンチルオキシフェニル、3, 4, 5-トリメトキシフェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、2-ブロモフェニル、3-ブロモフェニル、4-ブロモフェニル、2-ヨードフェニル、3-ヨードフェニル、4-ヨードフェニル、3, 4-ジクロロフェニル、3, 5-ジクロロフェニル、2, 6-ジクロロフェニル、2, 3-ジクロロフェニル、2, 4-ジクロロフェニル、3, 4-ジフルオロフェニル、3, 5-ジブロモフェニル、3, 4, 5-トリクロロフェニル、2-メトキシ-5-クロ

ロフェニル、3-クロロ-4-メトキシフェニル、3-メトキシ-5-ヨードフェニル、3, 4-ジメトキシ-5-ブロモフェニル、3, 5-ジヨード-4-メトキシフェニル基等のフェニル環上に置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシ基及びハロゲン原子なる群より選ばれた基を1~3個有することのあるフェニル基を例示できる。

【0105】窒素原子、酸素原子及び硫黄原子なる群より選ばれたヘテロ原子を1~4個有する5~6員環の飽和又は不飽和複素環基としては、例えば、ピロリジン、ピペリジン、ピペラジン、モルホリン、ピリジン、チエニル、ピラジン、ピリミジン、ピリダジン、ピロリル、イミダゾジン、ピラゾリル、イミダゾリル、ピラゾリジン、1, 3, 4-オキサジアゾリル、1, 2, 4-トリアゾリル、1, 2, 3, 4-テトラゾリル、1, 3, 4-トリアゾリル、1, 2, 4-オキサジアゾリル、フリル、ピロリニル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、チアゾリジン、1, 2, 3, 5-オキサチアジアゾリル、イソチアゾリル、ピラニル、ピラゾリジン、1, 2, 4-トリアジン基等を例示できる。

【0106】窒素原子、酸素原子及び硫黄原子なる群より選ばれたヘテロ原子を1~4個有する5~6員環の飽和又は不飽和複素環置換低級アルキル基としては、例えばピロリジンメチル、2-ピペリジンエチル、3-ピペラジンプロピル、4-モルホリンブチル、(2-ピリジン)メチル、(3-ピリジン)メチル、(2-チエニル)メチル、2-(3-ピラジン)エチル、1-(2-ピリミジン)エチル、3-(3-ピリダジン)プロピル、4-(2-ピロリル)ブチル、4-(4-イミダゾリジン)ブチル、(2-イミダゾリル)メチル、(3-ピラゾリル)メチル、2-(2-イミダゾリル)エチル、3-(3-ピラゾリジン)プロピル、チエニルメチル、3-(2-イミダゾリル)プロピル、4-(2-ピロリニル)ブチル、(2-フリル)メチル、(4-オキサゾリル)メチル、(5-オキサゾリル)メチル、5-(4-オキサゾリル)ペンチル、6-(3-イソオキサゾリル)ヘキシル、(4-チアゾリル)メチル、(2-チアゾリル)メチル、2-(3-イソチアゾリル)エチル、(2-ピラニル)メチル、3-(3-ピラゾリジン)プロピル、4-(2-ピラゾリニル)ブチル、(5-チアゾリル)メチル、(1, 3, 4-オキサジアゾリン-5-イル)メチル、(1, 2, 4-トリアゾール-5-イル)メチル、(1, 2, 3, 4-テトラゾール-5-イル)メチル、(1, 3, 4-トリアゾール-5-イル)メチル、(1, 2, 4-トリアジン-3-イル)メチル、(チアゾリジン-5-イル)メチル、(1, 2, 3, 5-オキサチアジアゾリン-4-イル)メチル、(2-フリル)メチル、(3-フ

リル)メチル、2-(5-チアゾリル)エチル、1-(1, 3, 4-オキサジアゾリン-2-イル)エチル、3-(1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)プロピル、4-(1, 2, 3, 4-テトラゾール-5-イル)ブチル、6-(1, 3, 4-トリアゾール-2-イル)ヘキシル、2-(1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル)エチル、1-(1, 2, 4-トリアジン-5-イル)エチル、3-(チアゾリジン-2-イル)プロピル、4-(1, 2, 3, 5-オキサチアジアゾリン-4-イル)ブチル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である前記複素環置換アルキル基を例示できる。

【0107】窒素原子、酸素原子及び硫黄原子なる群より選ばれたヘテロ原子を1~4個有する5~14員環の単環、二項環又は三項環の飽和又は不飽和複素環置換低級アルケニル基としては、例えば、2-ベンゾフリルビニル、3-ベンゾフリル-2-プロペニル、4-ベンゾフリル-3-ブテニル、3-ベンゾフリル-2-ブテニル、2-メチル-3-ベンゾフリル-2-プロペニル、5-ベンゾフリル-4-ペンテニル、5-ベンゾフリル-2-ペンテニル、4-ベンゾフリル-3-ペンテニル、6-ベンゾフリル-5-ヘキセニル、6-ベンゾフリル-4-ヘキセニル、6-ベンゾフリル-3-ヘキセニル、6-ベンゾフリル-2-ヘキセニル、 β -メチル-4-ベンゾフリル-3-ブテニル、5-ベンゾフリル-2, 4-ペンタジエニル、4-ベンゾフリル-1, 3-ブタジエニル、6-ベンゾフリル-2, 4-ヘキサジエニル、6-ベンゾフリル-3, 5-ヘキサジエニル、6-ベンゾフリル-1, 3-ヘキサジエニル、5-ベンゾフリル-1, 3-ペンタジエニル、2-ベンゾチエニルビニル、3-ベンゾチエニル-2-プロペニル、4-ベンゾチエニル-3-ブテニル、3-ベンゾチエニル-2-ブテニル、2-メチル-3-ベンゾチエニル-2-プロペニル、5-ベンゾチエニル-4-ペンテニル、5-ベンゾチエニル-2-ペンテニル、6-ベンゾチエニル-5-ヘキセニル、6-ベンゾチエニル-4-ヘキセニル、6-ベンゾチエニル-3-ヘキセニル、6-ベンゾチエニル-2-ヘキセニル、 β -メチル-4-ベンゾチエニル-3-ブテニル、5-ベンゾチエニル-2, 4-ペンタジエニル、4-ベンゾチエニル-1, 3-ブタジエニル、6-ベンゾチエニル-2, 4-ヘキサジエニル、6-ベンゾチエニル-3, 5-ヘキサジエニル、6-ベンゾチエニル-1, 3-ヘキサジエニル、5-ベンゾチエニル-1, 3-ペンタジエニル、2-(フロ

5-(フロ[3, 2-c]ピリジル)-2-ペンテニル、6-(フロ[3, 2-c]ピリジル)-5-ヘキセニル、6-(フロ[3, 2-c]ピリジル)-4-ヘキセニル、6-(フロ[3, 2-c]ピリジル)-3-ヘキセニル、6-(フロ[3, 2-c]ピリジル)-2-ヘキセニル、 β -メチル-4-(フロ[3, 2-c]ピリジル)-3-ブテニル、5-(フロ[3, 2-c]ピリジル)-2, 4-ペンタジエニル、4-(フロ[3, 2-c]ピリジル)-1, 3-ブタジエニル、6-(フロ[3, 2-c]ピリジル)-2, 4-ヘキサジエニル、6-(フロ[3, 2-c]ピリジル)-3, 5-ヘキサジエニル、6-(フロ[3, 2-c]ピリジル)-1, 3-ヘキサジエニル、5-(フロ[3, 2-c]ピリジル)-1, 3-ペンタジエニル、2-キノリルビニル、3-(1, 4-ジヒドロキノリル)-2-プロペニル、4-ベンゾチアゾリル-3-ブテニル、3-カルボスチリル-2-ブテニル、2-メチル-3-(3, 4-ジヒドロカルボスチリル)-2-プロペニル、5-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル)-4-ペンテニル、5-インドリル-2-ペンテニル、6-イソインドリル-5-ヘキセニル、6-インドリル-4-ヘキセニル、6-ベンゾイミダゾリル-3-ヘキセニル、6-ベンゾオキサゾリル-2-ヘキセニル、 β -メチル-4-イソキノリル-3-ブテニル、5-キナゾリジニル-2, 4-ペンタジエニル、4-シンノリル-1, 3-ブタジエニル、6-キノキサリニル-2, 4-ヘキサジエニル、6-フタラジニル-3, 5-ヘキサジエニル、6-クロマニル-1, 3-ヘキサジエニル、5-イソインドリニル-1, 3-ペンタジエニル、2-(4H-クロメニル)ビニル、3-(2, 3-ジヒドロ-2-ベンゾフリル)-2-プロペニル、4-(2-ベルヒドロベンゾフリル)-3-ブテニル、3-(1, 4-ベンゾオキサジニル)-2-ブテニル、2-メチル-3-(3, 4-ジヒドロ-2H-1, 4-ベンゾオキサジニル)-2-プロペニル、5-(1, 4-ベンゾチアジニル)-4-ペンテニル、5-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノキサリニル)-2-ペンテニル、6-(1, 3-ジチア-2, 4-ジヒドロナフタレニル)-5-ヘキセニル、6-(1, 4-ジチアナフタレニル)-4-ヘキセニル、6-(1, 4-ベンゾジオキサニル)-3-ヘキセニル、2-ピロリジニルビニル、3-ピロリジニル-2-プロペニル、4-ピロリジニル-3-ブテニル、3-ピロリジニル-2-ブテニル、2-メチル-3-ピロリジニル-2-プロペニル、5-ピロリジニル-4-ペンテニル、5-ピロリジニル-2-ペンテニル、4-ピロリジニル-3-ペンテニル、6-ピロリジニル-5-ヘキセニル、6-ピロリジニル-4-ヘキセニル、6-ピロリジニル-3-ヘキセニル、6-ピロリジニル-2-ヘキセニル、 β -メチル-4-ピロリジニル-3-ブテニル、5-ピロリジニル-2, 4-ペンタジ

エニル、4-ピロリジニル-1, 3-ブタジエニル、6-
 -ピロリジニル-2, 4-ヘキサジエニル、6-ピロリ
 ジニル-3, 5-ヘキサジエニル、6-ピロリジニル-
 1, 3-ヘキサジエニル、5-ピロリジニル-1, 3-
 ペンタジエニル、2-ビペリジニルビニル、3-ビペリ
 ジニル-2-プロペニル、4-ビペリジニル-3-ブテ
 ニル、3-ビペリジニル-2-ブテニル、2-メチル-
 3-ビペリジニル-2-プロペニル、5-ビペリジニル
 -4-ペンテニル、5-ビペリジニル-2-ペンテニ
 ル、6-ビペリジニル-5-ヘキセニル、6-ビペリジ
 ニル-4-ヘキセニル、6-ビペリジニル-3-ヘキセ
 ニル、6-ビペリジニル-2-ヘキセニル、 β -メチル
 -4-ビペリジニル-3-ブテニル、5-ビペリジニル
 -2, 4-ペンタジエニル、4-ビペリジニル-1, 3-
 ブタジエニル、6-ビペリジニル-2, 4-ヘキサジ
 エニル、6-ビペリジニル-3, 5-ヘキサジエニル、
 6-ビペリジニル-1, 3-ヘキサジエニル、5-ビペ
 リジニル-1, 3-ペンタジエニル、2-ビペラジニル
 ビニル、3-ビペラジニル-2-プロペニル、4-ビペ
 ラジニル-3-ブテニル、3-ビペラジニル-2-ブテ
 ニル、2-メチル-3-ビペラジニル-2-プロペニ
 ル、5-ビペラジニル-4-ペンテニル、5-ビペラジ
 ニル-2-ペンテニル、6-ビペラジニル-5-ヘキセ
 ニル、6-ビペラジニル-4-ヘキセニル、6-ビペラ
 ジニル-3-ヘキセニル、6-ビペラジニル-2-ヘキ
 セニル、 β -メチル-4-ビペラジニル-3-ブテニ
 ル、5-ビペラジニル-2, 4-ペンタジエニル、4-
 ビペラジニル-1, 3-ブタジエニル、6-ビペラジニ
 ル-2, 4-ヘキサジエニル、6-ビペラジニル-3,
 5-ヘキサジエニル、6-ビペラジニル-1, 3-ヘキ
 サジエニル、5-ビペラジニル-1, 3-ペンタジエニ
 ル、2-モルホリノビニル、3-ビリジニル-2-プロペ
 ニル、4-チエニル-3-ブテニル、3-ピラジニル-
 2-ブテニル、2-メチル-3-ビリミジニル-2-プロ
 ペニル、2-ピリダジニルビニル、3-ピロリル-2-
 プロペニル、4-イミダゾリル-3-ブテニル、3-イ
 ミダゾリル-2-ブテニル、2-メチル-3-イミダゾ
 リル-2-プロペニル、5-イミダゾリル-4-ペンテ
 ニル、5-イミダゾリル-2-ペンテニル、4-イミダ
 ザリル-3-ペンテニル、6-イミダゾリル-5-ヘキ
 セニル、6-イミダゾリル-4-ヘキセニル、6-イミ
 ダゾリル-3-ヘキセニル、6-イミダゾリル-2-ヘ
 キセニル、 β -メチル-4-イミダゾリル-3-ブテニ
 ル、5-イミダゾリル-2, 4-ペンタジエニル、4-
 イミダゾリル-1, 3-ブタジエニル、6-イミダゾリ
 ル-2, 4-ヘキサジエニル、6-イミダゾリル-3,
 5-ヘキサジエニル、6-イミダゾリル-1, 3-ヘキ
 サジエニル、5-イミダゾリル-1, 3-ペンタジエニ
 ル、2-イミダゾリジニルビニル、3-ピラゾリル-2
 -プロペニル、4-ピラゾリジニル-3-ブテニル、3-

-ペルヒドロベンゾフリル-2-ブテニル、2-メチル
 -3-(1, 3, 4-オキサジアゾリル)-2-プロペ
 ニル、5-(1, 2, 4-トリアゾリル)-4-ペンテ
 ニル、5-(1, 2, 3, 4-テトラゾリル)-2-ペ
 ンテニル、6-(1, 3, 4-トリアゾリル)-5-ヘ
 キセニル、6-(1, 2, 4-オキサジアゾリル)-4
 -ヘキセニル、6-(2, 3-ジヒドロ-2-ベンゾフ
 リル)-3-ヘキセニル、6-ピロリニル-2-ヘキセ
 ニル、 β -メチル-4-ノニル-3-ブテニル、5-イ
 ソオキサゾリル-2, 4-ペンタジエニル、4-チアゾ
 リル-1, 3-ブタジエニル、6-チアゾリジニル-
 2, 4-ヘキサジエニル、6-(1, 2, 3, 5-オキ
 サチアジアゾリル)-3, 5-ヘキサジエニル、6-イ
 ソチアゾリル-1, 3-ヘキサジエニル、5-ピラニル
 -1, 3-ペンタジエニル、2-オキサゾリルビニル、
 3-オキサゾリル-2-プロペニル、4-オキサゾリル
 -3-ブテニル、3-オキサゾリル-2-ブテニル、2-
 メチル-3-オキサゾリル-2-プロペニル、5-オ
 キサゾリル-4-ペンテニル、5-オキサゾリル-2-
 ペンテニル、4-オキサゾリル-3-ペンテニル、6-
 オキサゾリル-5-ヘキセニル、6-オキサゾリル-4
 -ヘキセニル、6-オキサゾリル-3-ヘキセニル、6
 -オキサゾリル-2-ヘキセニル、 β -メチル-4-オ
 キサゾリル-3-ブテニル、5-オキサゾリル-2, 4
 -ペンタジエニル、4-オキサゾリル-1, 3-ブタジ
 エニル、6-オキサゾリル-2, 4-ヘキサジエニル、
 6-オキサゾリル-3, 5-ヘキサジエニル、6-オキ
 サゾリル-1, 3-ヘキサジエニル、5-オキサゾリル
 -1, 3-ペンタジエニル、2-ピラゾリルビニル、3
 -キヌクリジニル-2-プロペニル、4-ベンゾチアゾ
 リル-3-ブテニル、3-カルボスチリル-2-ブテニ
 ル、2-メチル-3-(3, 4-ジヒドロ[2, 3-
 g]キノリル)-2-プロペニル、5-(1, 2, 3,
 4-テトラヒドロフロ[2, 3-g]キノリル)-4-
 ペンテニル、2-(ナフト[2, 1-b]フリル)ビニ
 ル、3-(ナフト[2, 1-b]フリル)-2-プロペ
 ニル、4-(ナフト[2, 1-b]フリル)-3-ブテ
 ニル、3-(ナフト[2, 1-b]フリル)-2-ブテ
 ニル、2-メチル-3-(ナフト[2, 1-b]フリ
 ル)-2-プロペニル、5-(ナフト[2, 1-b]フ
 リル)-4-ペンテニル、5-(ナフト[2, 1-b]
 フリル)-2-ペンテニル、4-(ナフト[2, 1-
 b]フリル)-3-ペンテニル、6-(ナフト[2, 1
 -b]フリル)-5-ヘキセニル、6-(ナフト[2,
 1-b]フリル)-4-ヘキセニル、6-(ナフト
 [2, 1-b]フリル)-3-ヘキセニル、6-(ナフ
 ト[2, 1-b]フリル)-2-ヘキセニル、 β -メチ
 ル-4-(ナフト[2, 1-b]フリル)-3-ブテニ
 ル、5-(ナフト[2, 1-b]フリル)-2, 4-ペ
 ンタジエニル、4-(ナフト[2, 1-b]フリル)-

1, 3-ブタジエニル、6-(ナフト〔2, 1-b〕フリル)-2, 4-ヘキサジエニル、6-(ナフト〔2, 1-b〕フリル)-3, 5-ヘキサジエニル、6-(ナフト〔2, 1-b〕フリル)-1, 3-ヘキサジエニル、5-(ナフト〔2, 1-b〕フリル)-1, 3-ペンタジエニル、2-(イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジル)ビニル、3-(イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジル)-2-プロペニル、4-(イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジル)-3-ブテニル基等のアルケニル部分が炭素数2~6の直鎖又は分枝鎖状の二重結合を1~2個有するアルケニル基である上記複素環置換アルケニル基を挙げることができる。

【0108】フェニル低級アルコキシカルボニル基としては、例えば、ベンジルオキシカルボニル、2-フェニルエトキシカルボニル、1-フェニルエトキシカルボニル、3-フェニルプロポキシカルボニル、4-フェニルブトキシカルボニル、5-フェニルペンチルオキシカルボニル、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル、1, 1-ジメチル-2-フェニルエトキシカルボニル、2-メチル-3-フェニルプロポキシカルボニル基等のアルコキシカルボニル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニル基であるフェニルアルコキシカルボニル基を挙げることができる。

【0109】低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基としては、例えば、メトキシカルボニルオキシメチル、エトキシカルボニルオキシメチル、2-エトキシカルボニルオキシエチル、1-エトキシカルボニルオキシエチル、3-メトキシカルボニルオキシプロピル、4-エトキシカルボニルオキシブチル、6-プロポキシカルボニルオキシヘキシル、5-イソプロポキシカルボニルオキシペンチル、1, 1-ジメチル-2-ブトキシカルボニルオキシエチル、2-メチル-3-tert-ブトキシカルボニルオキシプロピル、2-ペンチルオキシカルボニルオキシエチル、ヘキシルオキシカルボニルオキシメチル基等のアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基である炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルコキシカルボニルオキシアルキル基を例示できる。

【0110】フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基としては、例えばベンゾイルメチル、1-(2-クロロベンゾイル)エチル、2-(3-クロロベンゾイル)エチル、3-(4-クロロベンゾイル)プロピル、4-(2-フルオロベンゾイル)ブチル、1, 1-ジメチル-2-(3-フルオロベンゾイル)エチル、5-(4-フルオロベンゾイル)ペンチル、6-(2-ブロモベンゾイル)ヘキシル、2-メチル-3-(3-ブロモベンゾイル)プロピル、(4-ブロモベンゾイル)メチル、2-(2-ヨードベンゾイル)エチル、1-(4-ヨードベンゾイル)エチル、(3, 5-ジクロロベンゾイ

ル)メチル、2-(2, 6-ジクロロベンゾイル)エチル、1-(3, 4-ジクロロベンゾイル)エチル、3-(3, 4-ジフルオロベンゾイル)プロピル、(3, 5-ジブロモベンゾイル)メチル、(3, 4, 5-トリクロロベンゾイル)メチル基等のフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を1~3個有することがあり、且つアルキル部分が炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基であるフェニルアルキル基を例示できる。

【0111】置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基としては、例えば、アミノ、ホルミルアミノ、アセチルアミノ、プロピオニルアミノ、ブチリルアミノ、イソブチリルアミノ、ペンタノイルアミノ、tert-ブチルカルボニルアミノ、ヘキサノイルアミノ基等の置換基として炭素数1~6の直鎖又は分枝鎖状アルカノイル基を有することのあるアミノ基を例示できる。

【0112】本発明化合物には以下の化合物が含まれる。

【0113】(1) R^1 が水素原子を示し、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0114】(2) R^1 がハロゲン原子を示し、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0115】(3) R^1 が低級アルキル基を示し、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0116】(4) R^2 が水素原子を示し、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0117】(5) R^2 が置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0118】(6) R^2 がフェニル基を示し、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0119】(7) R^2 がモルホリノ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0120】(8) R^2 がイミダゾリル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0121】(9) R^3 が水素原子で、 R^4 が上記〔化27〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0122】(10) R^3 が低級アルキル基で R^4 が上記

〔化27〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0123】(11) R^3 が水素原子を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基- $O-A_4-CO-NR^{40}R^{41}$ (A_4 、 R^{40} 及び R^{41} は前記に同じ)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0124】(12) R^3 が低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基- $O-A_4-CO-N-R^{40}R^{41}$ (A_4 、 R^{40} 及び R^{41} は前記に同じ)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0125】(13) R^3 が水素原子を示し、 R^4 が低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0126】(14) R^3 が低級アルキル基を示し、 R^4 が低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0127】(15) R^3 が水素原子を示し、 R^4 がシクロアルキル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0128】(16) R^3 が低級アルキル基を示し、 R^4 がシクロアルキル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0129】(17) R^3 が水素原子を示し、 R^4 がナフチル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリ

ン誘導体又はその塩。

【0130】(18) R^3 が低級アルキル基を示し、 R^4 がナフチル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0131】(19) R^3 が水素原子を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0132】(20) R^3 が低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0133】(21) R^3 が水素原子を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0134】(22) R^3 が低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0135】(23) R^3 が水素原子を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0136】(24) R^3 が低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0137】(25) R^3 が水素原子を示し、 R^4 がフェノキシ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0138】(26) R^3 が低級アルキル基を示し、 R^4 がフェノキシ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0139】(27) R^3 が水素原子を示し、 R^4 が上記〔化28〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0140】(28) R^3 が低級アルキル基を示し、 R^4 が上記〔化28〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、

m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0141】(29) R^3 が水素原子を示し、 R^4 が基— $A_5 - CR^{42}R^{43}R^{44}$ (A_5 、 R^{42} 、 R^{43} 及び R^{44} は前記に同じ)を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0142】(30) R^3 が低級アルキル基を示し、 R^4 が基— $A_5 - CR^{42}R^{43}R^{44}$ (A_5 、 R^{42} 、 R^{43} 及び R^{44} は前記に同じ)を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0143】(31) R^3 が水素原子を示し、 R^4 が2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキソ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0144】(32) R^3 が低級アルキル基を示し、 R^4 が2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキソ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0145】(33) R^3 が水素原子を示し、 R^4 が上記〔化34〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0146】(34) R^3 が低級アルキル基を示し、 R^4 が上記〔化34〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0147】(35) R^3 及び R^4 は、これらが結合する窒素原子と共に結合して形成する1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル基(該基上には低級アルコキシ基を有していてもよい)を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0148】(36) R^1 が前記(2)又は(3)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(9)又は(10)の定義を示し、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0149】(37) R^1 が前記(2)又は(3)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(11)又は(12)の定義を示し、m、n及びrは前記に同じ

である一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0150】(38) R^1 が前記(2)又は(3)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(13)又は(14)の定義を示し、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0151】(39) R^1 が前記(2)又は(3)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(15)又は(16)の定義を示し、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0152】(40) R^1 が前記(2)又は(3)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(17)又は(18)の定義を示し、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0153】(41) R^1 が前記(2)又は(3)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(17)又は(18)の定義を示し、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0154】(42) R^1 が前記(2)又は(3)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(19)又は(20)の定義を示し、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0155】(43) R^1 が前記(2)又は(3)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(21)又は(22)の定義を示し、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0156】(44) R^1 が前記(2)又は(3)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(23)又は(24)の定義を示し、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0157】(45) R^1 が前記(2)又は(3)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(25)又は(26)の定義を示し、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0158】(46) R^1 が前記(2)又は(3)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(27)又は(28)の定義を示し、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0159】(47) R^1 が前記(2)又は(3)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(29)又は(30)の定義を示し、m、n及びrは前記に同じ

【0179】(67) R^1 が前記(2)又は(3)の定義を示し、 R^2 が前記(6)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(13)又は(14)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0189】(77) R^1 が前記(2)又は(3)の定義を示し、 R^2 が前記(6)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(33)又は(34)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0200】(88) R^1 が前記(2) 又は(3) の定義を示

は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0234】(122) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(24)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0235】(123) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(25)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【０２３６】(124) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(26)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0237】(125) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(27)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0238】(126) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(28)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0239】(127) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(29)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0240】(128) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(30)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0241】(129) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(31)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0242】(130) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(32)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0243】(131) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(33)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0244】(132) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(34)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩

【0245】(133) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(35)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0246】(134) R^1 が低級アルコキシ基を示し、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0247】(135) R^1 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基を示し、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0248】(136) R^1 が置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基を示し、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0249】(137) R^3 がフェニル低級アルコキシカルボニル基で、 R^4 が上記〔化27〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0250】(138) R^3 が低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基で、 R^4 が上記〔化27〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0251】(139) R^3 がフェニル低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基 $-O-A_4-CO-NR^{40}R^{41}$ (A_4 、 R^{40} 及び R^{41} は前記に同じ)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0252】(140) R^3 が低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基 $-O-A_4-CO-NR^{40}R^{41}$ (A_4 、 R^{40} 及び R^{41} は前記に同じ)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0253】(141) R^3 がフェニル低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 が低級アルケニル基を示し、

R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0254】(142) R^3 が低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 が低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0255】(143) R^3 がフェニル低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 がシクロアルキル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0256】(144) R^3 が低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 がシクロアルキル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0257】(145) R^3 がフェニル低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 がナフチル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0258】(146) R^3 が低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 がナフチル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0259】(147) R^3 がフェニル低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0260】(148) R^3 が低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0261】(149) R^3 がフェニル低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0262】(150) R^3 が低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0263】(151) R^3 がフェニル低級アルコキシカル

ボニル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0264】(152) R^3 が低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0265】(153) R^3 がフェニル低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 がフェノキシ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0266】(154) R^3 が低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 がフェノキシ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0267】(155) R^3 がフェニル低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 が上記〔化28〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0268】(156) R^3 が低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 が上記〔化28〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0269】(157) R^3 がフェニル低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 が基 $-A_5-CR^{42}R^{43}R^{44}$ (R^{42} 、 R^{43} 及び R^{44} は前記に同じ)を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0270】(158) R^3 が低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 が基 $-A_5-CR^{42}R^{43}R^{44}$ (R^{42} 、 R^{43} 及び R^{44} は前記に同じ)を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0271】(159) R^3 がフェニル低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 が2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキソ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0272】(160) R^3 が低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 が2, 3-ジヒドロ-1H-

インデニル環上に置換基としてオキソ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0273】(161) R^3 がフェニル低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 が上記〔化34〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0274】(162) R^3 が低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 が上記〔化34〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0275】(163) R^3 が低級アルカノイル基で、 R^4 が上記〔化27〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0276】(164) R^3 が低級アルコキシカルボニル基で R^4 が上記〔化27〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0277】(165) R^3 が低級アルカノイル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基 $-O-A_4-CO-NR^{40}R^{41}$ (A_4 、 R^{40} 及び R^{41} は前記に同じ)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0278】(166) R^3 が低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基 $-O-A_4-CO-NR^{40}R^{41}$ (A_4 、 R^{40} 及び R^{41} は前記に同じ)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式

(1) で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0279】(167) R^3 が低級アルカノイル基を示し、 R^4 が低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0280】(168) R^3 が低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 が低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0281】(169) R^3 が低級アルカノイル基を示し、 R^4 がシクロアルキル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0282】(170) R^3 が低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 がシクロアルキル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0283】(171) R^3 が低級アルカノイル基を示し、 R^4 がナフチル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0284】(172) R^3 が低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 がナフチル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0285】(173) R^3 が低級アルカノイル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0286】(174) R^3 が低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0287】(175) R^3 が低級アルカノイル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0288】(176) R^3 が低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0289】(177) R^3 が低級アルカノイル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を

有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0290】(178) R^3 が低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0291】(179) R^3 が低級アルカノイル基を示し、 R^4 がフェノキシ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0292】(180) R^3 が低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 がフェノキシ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0293】(181) R^3 が低級アルカノイル基を示し、 R^4 が上記〔化28〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0294】(182) R^3 が低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 が上記〔化28〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0295】(183) R^3 が低級アルカノイル基を示し、 R^4 が基- A_5 - $CR^{42}R^{43}R^{44}$ (R^{42} 、 R^{43} 及び R^{44} は前記に同じ)を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0296】(184) R^3 が低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 が基- A_5 - $CR^{42}R^{43}R^{44}$ (R^{42} 、 R^{43} 及び R^{44} は前記に同じ)を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0297】(185) R^3 が低級アルカノイル基を示し、 R^4 が2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキシ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0298】(186) R^3 が低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 が2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキシ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、

n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0299】(187) R^3 が低級アルカノイル基を示し、 R^4 が上記〔化34〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0300】(188) R^3 が低級アルコキシカルボニル基を示し、 R^4 が上記〔化34〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0301】(189) R^3 が低級アルコキシ低級アルキル基で、 R^4 が上記〔化27〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0302】(190) R^3 がフェノキシカルボニル基で R^4 が上記〔化27〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0303】(191) R^3 が低級アルコキシ低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基-O-A₄-CO-NR⁴⁰R⁴¹(A₄、R⁴⁰及びR⁴¹は前記に同じ)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0304】(192) R^3 がフェノキシカルボニル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基-O-A₄-CO-N-R⁴⁰R⁴¹(A₄、R⁴⁰及びR⁴¹は前記に同じ)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0305】(193) R^3 が低級アルコキシ低級アルキル基を示し、 R^4 が低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0306】(194) R^3 がフェノキシカルボニル基を示し、 R^4 が低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0307】(195) R^3 が低級アルコキシ低級アルキル基を示し、 R^4 がシクロアルキル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0308】(196) R^3 がフェノキシカルボニル基を示し、 R^4 がシクロアルキル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0309】(197) R^3 が低級アルコキシ低級アルキル基を示し、 R^4 がナフチル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0310】(198) R^3 がフェノキシカルボニル基を示し、 R^4 がナフチル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0311】(199) R^3 が低級アルコキシ低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0312】(200) R^3 がフェノキシカルボニル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0313】(201) R^3 が低級アルコキシ低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0314】(202) R^3 がフェノキシカルボニル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0315】(203) R^3 が低級アルコキシ低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0316】(204) R^3 がフェノキシカルボニル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0317】(205) R^3 が低級アルコキシ低級アルキル基を示し、 R^4 がフェノキシ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0318】(206) R^3 がフェノキシカルボニル基を示し、 R^4 がフェノキシ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0319】(207) R^3 が低級アルコキシ低級アルキル基を示し、 R^4 が上記〔化28〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0320】(208) R^3 がフェノキシカルボニル基を示し、 R^4 が上記〔化28〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0321】(209) R^3 が低級アルコキシ低級アルキル基を示し、 R^4 が基 $-A_5-CR^{42}R^{43}R^{44}$ (A_5 、 R^{42} 、 R^{43} 及び R^{44} は前記に同じ)を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0322】(210) R^3 がフェノキシカルボニル基を示し、 R^4 が基 $-A_5-CR^{42}R^{43}R^{44}$ (A_5 、 R^{42} 、 R^{43} 及び R^{44} は前記に同じ)を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0323】(211) R^3 が低級アルコキシ低級アルキル基を示し、 R^4 が2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキシ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0324】(212) R^3 がフェノキシカルボニル基を示し、 R^4 が2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキシ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0325】(213) R^3 が低級アルコキシ低級アルキル基を示し、 R^4 が上記〔化34〕で示される基を示し、

R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0326】(214) R^3 がフェノキシカルボニル基を示し、 R^4 が上記〔化34〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0327】(215) R^3 が低級アルカノイル基置換低級アルキル基で、 R^4 が上記〔化27〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0328】(216) R^3 が低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基で R^4 が上記〔化27〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0329】(217) R^3 が低級アルカノイル基置換低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基 $-O-A_4-CO-NR^{40}R^{41}$ (A_4 、 R^{40} 及び R^{41} は前記に同じ)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0330】(218) R^3 が低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基 $-O-A_4-CO-NR^{40}R^{41}$ (A_4 、 R^{40} 及び R^{41} は前記に同じ)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0331】(219) R^3 が低級アルカノイル基置換低級アルキル基を示し、 R^4 が低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0332】(220) R^3 が低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 が低級アルケニル

基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0333】(221) R^3 が低級アルカノイル置換低級アルキル基を示し、 R^4 がシクロアルキル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0334】(222) R^3 が低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 がシクロアルキル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0335】(223) R^3 が低級アルカノイル基置換低級アルキル基を示し、 R^4 がナフチル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0336】(224) R^3 が低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 がナフチル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0337】(225) R^3 が低級アルカノイル基置換低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0338】(226) R^3 が低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0339】(227) R^3 が低級アルカノイル基置換低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0340】(228) R^3 が低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0341】(229) R^3 が低級アルカノイル基置換低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び

r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0342】(230) R^3 が低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0343】(231) R^3 が低級アルカノイル基置換低級アルキル基を示し、 R^4 がフェノキシ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0344】(232) R^3 が低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 がフェノキシ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0345】(233) R^3 が低級アルカノイル基置換低級アルキル基を示し、 R^4 が上記〔化28〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0346】(234) R^3 が低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 が上記〔化28〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0347】(235) R^3 が低級アルカノイル基置換低級アルキル基を示し、 R^4 が基 $-A_5-CR^{42}R^{43}R^{44}$ (A_5 、 R^{42} 、 R^{43} 及び R^{44} は前記に同じ)を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0348】(236) R^3 が低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 が基 $-A_5-CR^{42}R^{43}R^{44}$ (A_5 、 R^{42} 、 R^{43} 及び R^{44} は前記に同じ)を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0349】(237) R^3 が低級アルカノイル基置換低級アルキル基を示し、 R^4 が2,3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキソ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2,3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0350】(238) R^3 が低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 が2,3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキソ基、水

酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0351】(239) R^3 が低級アルカノイル基置換低級アルキル基を示し、 R^4 が上記〔化34〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0352】(240) R^3 が低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 が上記〔化34〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0353】(241) R^3 がフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基で、 R^4 が上記〔化27〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0354】(242) R^3 が基- $E-NR^{52}R^{53}$ (E 、 R^{52} 及び R^{53} は前記に同じ)を示し、 R^4 が上記〔化27〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0355】(243) R^3 がフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基- $O-A_4-CO-NR^{40}R^{41}$ (A_4 、 R^{40} 及び R^{41} は前記に同じ)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0356】(244) R^3 が基- $E-NR^{52}R^{53}$ (E 、 R^{52} 及び R^{53} は前記に同じ)を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基- $O-A_4-CO-NR^{40}R^{41}$ (A_4 、 R^{40} 及び R^{41} は前記に同じ)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基と

してハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0357】(245) R^3 がフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基を示し、 R^4 が低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0358】(246) R^3 が基- $E-NR^{52}R^{53}$ (E 、 R^{52} 及び R^{53} は前記に同じ)を示し、 R^4 が低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0359】(247) R^3 がフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基を示し、 R^4 がシクロアルキル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0360】(248) R^3 が基- $E-NR^{52}R^{53}$ (E 、 R^{52} 及び R^{53} は前記に同じ)を示し、 R^4 がシクロアルキル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0361】(249) R^3 がフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基を示し、 R^4 がナフチル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0362】(250) R^3 が基- $E-NR^{52}R^{53}$ (E 、 R^{52} 及び R^{53} は前記に同じ)を示し、 R^4 がナフチル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0363】(251) R^3 がフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0364】(252) R^3 が基- $E-NR^{52}R^{53}$ (E 、 R^{52} 及び R^{53} は前記に同じ)を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0365】(253) R^3 がフェニル環上に置換基として

ハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0366】(254) R^3 が基 $-E-NR^{52}R^{53}$ (E 、 R^{52} 及び R^{53} は前記に同じ)を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0367】(255) R^3 がフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0368】(256) R^3 が基 $-E-NR^{52}R^{53}$ (E 、 R^{52} 及び R^{53} は前記に同じ)を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0369】(257) R^3 がフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基を示し、 R^4 がフェノキシ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0370】(258) R^3 が基 $-E-NR^{52}R^{53}$ (E 、 R^{52} 及び R^{53} は前記に同じ)を示し、 R^4 がフェノキシ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0371】(259) R^3 がフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基を示し、 R^4 が上記〔化28〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0372】(260) R^3 が基 $-E-NR^{52}R^{53}$ (E 、 R^{52} 及び R^{53} は前記に同じ)を示し、 R^4 が上記〔化28〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0373】(261) R^3 がフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基を示し、 R^4 が基 $-A_5-CR^{42}R^{43}R^{44}$ (A_5 、 R^{42} 、 R^{43} 及び R^{44} は前記に同じ)を示し、 R^1 、

R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0374】(262) R^3 が基 $-E-NR^{52}R^{53}$ (E 、 R^{52} 及び R^{53} は前記に同じ)を示し、 R^4 が基 $-A_5-CR^{42}R^{43}R^{44}$ (A_5 、 R^{42} 、 R^{43} 及び R^{44} は前記に同じ)を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0375】(263) R^3 がフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基を示し、 R^4 が2,3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキシ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2,3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0376】(264) R^3 が基 $-E-NR^{52}R^{53}$ (E 、 R^{52} 及び R^{53} は前記に同じ)を示し、 R^4 が2,3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキシ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2,3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0377】(265) R^3 がフェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基を示し、 R^4 が上記〔化34〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0378】(266) R^3 が基 $-E-NR^{52}R^{53}$ (E 、 R^{52} 及び R^{53} は前記に同じ)を示し、 R^4 が上記〔化34〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0379】(267) R^3 が上記〔化26〕で示される基を示し、 R^4 が上記〔化27〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0380】(268) R^3 が上記〔化26〕で示される基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基 $-O-A_4-CO-NR^{40}R^{41}$ (A_4 、 R^{40} 及び R^{41} は前記に同じ)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有するこ

とのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0381】(269) R^3 が上記〔化26〕で示される基を示し、 R^4 が低級アルケニル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0382】(270) R^3 が上記〔化26〕で示される基を示し、 R^4 がシクロアルキル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0383】(271) R^3 が上記〔化26〕で示される基を示し、 R^4 がナフチル低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0384】(272) R^3 が上記〔化26〕で示される基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0385】(273) R^3 が上記〔化26〕で示される基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0386】(274) R^3 が上記〔化26〕で示される基を示し、 R^4 がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0387】(275) R^3 が上記〔化26〕で示される基を示し、 R^4 がフェノキシ置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0388】(276) R^3 が上記〔化26〕で示される基を示し、 R^4 が上記〔化28〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0389】(277) R^3 が上記〔化26〕で示される基を示し、 R^4 が基 $-A_5-CR^{42}R^{43}R^{44}$ (A_5 、 R^{42} 、 R^{43} 及び R^{44} は前記に同じ)を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0390】(278) R^3 が上記〔化26〕で示される基を示し、 R^4 が2,3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキソ基、水酸基及び置換基として低

級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2,3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0391】(279) R^3 が上記〔化26〕で示される基を示し、 R^4 が上記〔化34〕で示される基を示し、 R^1 、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0392】(280) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(9)又は(10)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0393】(281) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(11)又は(12)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0394】(282) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(13)又は(14)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0395】(283) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(15)又は(16)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0396】(284) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(17)又は(18)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0397】(285) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(17)又は(18)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0398】(286) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(19)又は(20)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0399】(287) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(21)又は(22)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0400】(288) R^1 が前記(134)、(135)又は(13

【0440】(328) R^1 が前記(134)、(135)又は(13

6) の定義を示し、 R^2 が前記(8) の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(31)又は(32)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0461】(349) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(8)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(33)又は(34)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0462】(350) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(8)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(35)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0463】(351) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(137)、(138)、(163)、(164)、(189)、(190)、(215)、(216)、(241)、(242)又は(267)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0464】(352) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(139)、(140)、(165)、(166)、(191)、(192)、(217)、(218)、(243)、(244)又は(268)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0465】(353) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(141)、(142)、(167)、(168)、(193)、(194)、(219)、(220)、(245)、(246)又は(269)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0466】(354) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(143)、(144)、(169)、(170)、(195)、(196)、(221)、(222)、(247)、(248)又は(270)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0467】(355) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(145)、(146)、(171)、(172)、(197)、(198)、(223)、(224)、(249)、(250)又は(271)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0468】(356) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(147)、(148)、(173)、(174)、(199)、(200)、(225)、(226)、(251)、(252)又は(272)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0469】(357) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(149)、(150)、(175)、(176)、(201)、(202)、(227)、(228)、(253)、(254)又は(273)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0470】(358) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(151)、(152)、(177)、(178)、(203)、(204)、(229)、(230)、(255)、(256)又は(274)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0471】(359) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(153)、(154)、(179)、(180)、(205)、(206)、(231)、(232)、(257)、(258)又は(275)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0472】(360) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(155)、(156)、(181)、(182)、(207)、(208)、(233)、(234)、(259)、(260)又は(276)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0473】(361) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(157)、(158)、(183)、(184)、(209)、(210)、(235)、(236)、(261)、(262)又は(277)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0474】(362) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(159)、(160)、(185)、(186)、(211)、(212)、(237)、(238)、(263)、(264)又は(278)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0475】(363) R^1 が前記(1)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(161)、(162)、(187)、(188)、(213)、(214)、(239)、(240)、(265)、(266)又は(279)の定義を示し、 R^2 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0476】(364) R^1 が前記(2)又は(3)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(137)、(138)、(163)、(164)、(189)、(190)、(215)、(216)、(241)、(242)又は(267)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0477】(365) R^1 が前記(2)又は(3)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記

【0510】(398) R^1 が前記(2)又は(3)の定義を示し、 R^2 が前記(6)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(153)、(154)、(179)、(180)、(205)、(206)、(231)、(232)、(257)、(258)又は(275)の定義を示

【0518】(406) R^1 が前記(2)又は(3)の定義を示し、 R^2 が前記(7)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(143)、(144)、(169)、(170)、(195)、(196)、(221)、(222)、(247)、(248)又は(270)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0527】(415) R^1 が前記(2) 又は(3) の定義を示し、 R^2 が前記(7) の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記

【0543】(431) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(4)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(141)、(142)、(167)、(168)、(193)、(194)、(219)、(220)、(245)、(246)又は(269)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0568】(456) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(6)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(139)、(140)、(165)、(166)、(191)、(192)、(217)、(218)、(243)、(244)又は(268)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0577】(465) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(6)の定義を示し、 R^3

【0593】(481) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(8)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(137)、(138)、(163)、(164)、(189)、(190)、(215)、(216)、(241)、(242)又は(267)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩、

【0594】(482) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(8)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(139)、(140)、(165)、(166)、(191)、(192)、(217)、(218)、(243)、(244)又は(268)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0595】(483) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(8)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(141)、(142)、(167)、(168)、(193)、(194)、(219)、(220)、(245)、(246)又は(269)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0596】(484) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(8)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(143)、(144)、(169)、(170)、(195)、(196)、(221)、(222)、(247)、(248)又は(270)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0597】(485) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(8)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(145)、(146)、(171)、(172)、(197)、(198)、(223)、(224)、(249)、(250)又は(271)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0598】(486) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(8)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(147)、(148)、(173)、(174)、(199)、(200)、(225)、(226)、(251)、(252)又は(272)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0599】(487) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(8)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(149)、(150)、(175)、(176)、(201)、(202)、(227)、(228)、(253)、(254)又は(273)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0600】(488) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(8)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(151)、(152)、(177)、(178)、(203)、(204)、(229)、(230)、(255)、(256)又は(274)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0601】(489) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(8)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(153)、(154)、(179)、(180)、(205)、(206)、(231)、(232)、(257)、(258)又は(275)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0602】(490) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(8)の定義を示し、 R^3

及び R^4 が前記(155)、(156)、(181)、(182)、(207)、(208)、(233)、(234)、(259)、(260)又は(276)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0603】(491) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(8)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(157)、(158)、(183)、(184)、(209)、(210)、(235)、(236)、(261)、(262)又は(277)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0604】(492) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(8)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(159)、(160)、(185)、(186)、(211)、(212)、(237)、(238)、(263)、(264)又は(278)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0605】(493) R^1 が前記(134)、(135)又は(136)の定義を示し、 R^2 が前記(8)の定義を示し、 R^3 及び R^4 が前記(161)、(162)、(187)、(188)、(213)、(214)、(239)、(240)、(265)、(266)又は(279)の定義を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0606】(494) m が1であり、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0607】(495) m が0であり、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0608】(496) R^1 が水素原子を示し、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0609】(497) R^1 がハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基を示し、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0610】(498) R^1 が水素原子を示し、 R^2 が置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基を示し、 R^3 、 R^4 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0611】(499) R^1 が水素原子を示し、 R^2 が水素原子、フェニル基、モルホリノ置換低級アルキル基又はイミダゾリル置換低級アルキル基を示し、 R^3 、 R^4 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0612】(500) R^1 がハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基又は置換基として低級アルキ

ル基を有することのあるアミノカルボニル基を示し、 R^2 が置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基を示し、 R^3 、 R^4 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0613】(501) R^1 がハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基を示し、 R^2 が水素原子、フェニル基、モルホリノ置換低級アルキル基又はイミダゾリル置換低級アルキル基を示し、 R^3 、 R^4 、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0614】(502) R^1 が水素原子を示し、 R^2 が置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基を示し、 R^3 が水素原子、低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基又は低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 が上記〔化28〕で示される基又は上記〔化34〕で示される基を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0615】(503) R^1 が水素原子を示し、 R^2 が置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基を示し、 R^3 が水素原子、低級アルキル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基又は低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 が上記〔化27〕で示される基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基- $O-A_4-CO-NR^{40}R^{41}$ (A_4 は低級アルキレン基を示す。 R^{40} 及び R^{41} は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。また R^{40} 及び R^{41} は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5員又は6員の飽和複素環を形成してもよい。)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基；アルケニル基；シクロアルキル低級アルキル基；ナフチル低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキ

ル基；フェノキシ置換低級アルキル基；基- $A_5-CR^{42}R^{43}R^{44}$ (式中 A_5 は低級アルキレン基を示す。 R^{42} 及び R^{43} は一緒になって基= O 、基= $N-OH$ 又は低級アルキレンジオキシ基を形成するものとする。 R^{44} はフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニル基を示す。)又は2,3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキソ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2,3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基を示し、 m 、 n 及び r は前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0616】(504) R^1 が水素原子を示し、 R^2 が置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基を示し、 R^3 がフェニル低級アルコキシカルボニル基；低級アルカノイル基；低級アルコキシ低級アルキル基；フェノキシカルボニル基；低級アルカノイル基置換低級アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基；基- $E-R^{52}R^{53}$ (R^{52} 及び R^{53} は、同一又は異なって水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基又はフェニル基を示す。 R^{52} 及び R^{53} は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5員又は6員環の飽和複素環を形成してもよい。 E は低級アルキレン基、基- $C(=O)-$ 又は基- $C(=O)-A-(A$ は低級アルキレン基)を示す。)又は状は〔化26〕で示される基を示し、 R^4 が上記〔化27〕で示される基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基- $O-A_4-CO-NR^{40}R^{41}$ (A_4 は低級アルキレン基を示す。 R^{40} 及び R^{41} は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。また R^{40} 及び R^{41} は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5員又は6員の飽和複素環を形成してもよい。)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基；アルケニル基；シクロアルキル低級アルキル基；ナフチル低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキ

ル基；フェノキシ置換低級アルキル基；上記〔化28〕で示される基；基-A₅-CR⁴²R⁴³R⁴⁴（式中A₅は低級アルキレン基を示す。R⁴²及びR⁴³は一緒になって基=O、基=N-OH又は低級アルキレンジオキシ基を形成するものとする。R⁴⁴はフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニル基を示す。）；2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキソ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基又は上記〔化34〕で示される基を示し、m、n及びrは前記に同じである一般式（1）で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0617】(505) R¹ が水素原子を示し、R² が置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基を示し、R³ 及びR⁴ はこれらが結合する窒素原子と共に結合して形成される1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリン基（この複素環上には置換基として低級アルコキシ基を有していてもよい）であり、m、n及びrは前記に同じである一般式（1）で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0618】(506) R¹ が水素原子を示し、R² が水素原子、フェニル基、モルホリノ置換低級アルキル基又はイミダゾリル置換低級アルキル基を示し、R³ が水素原子、低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基又は低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基を示し、R⁴ が上記〔化28〕で示される基又は上記〔化34〕で示される基を示し、m、n及びrは前記に同じである一般式（1）で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0619】(507) R¹ が水素原子を示し、R² が水素原子、フェニル基、モルホリノ置換低級アルキル基又はイミダゾリル置換低級アルキル基を示し、R³ が水素原子、低級アルキル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基又は低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基を示し、R⁴ が上記〔化27〕で示される基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基-O-A₄-CO-NR⁴⁰R⁴¹（A₄は低級アルキレン基を示す。R⁴⁰及びR⁴¹は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。またR⁴⁰及びR⁴¹は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5員又は6員の飽和複素環を形成してもよい。）、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級

アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基；アルケニル基；シクロアルキル低級アルキル基；ナフチル低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基；フェノキシ置換低級アルキル基；基-A₅-CR⁴²R⁴³R⁴⁴（式中A₅は低級アルキレン基を示す。R⁴²及びR⁴³は一緒になって基=O、基=N-OH又は低級アルキレンジオキシ基を形成するものとする。R⁴⁴はフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニル基を示す。）又は2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキソ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基を示し、m、n及びrは前記に同じである一般式（1）で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0620】(508) R¹ が水素原子を示し、R² が水素原子、フェニル基、モルホリノ置換低級アルキル基又はイミダゾリル置換低級アルキル基を示し、R³ がフェニル低級アルコキシカルボニル基；低級アルカノイル基；低級アルコキシ低級アルキル基；フェノキシカルボニル基；低級アルカノイル基置換低級アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基；基-E-R⁵²R⁵³（R⁵²及びR⁵³は、同一又は異なって水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基又はフェニル基を示す。R⁵²及びR⁵³は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5員又は6員環の飽和複素環を形成してもよい。Eは低級アルキレン基、基-C(=O)-又は基-C(=O)-A-(Aは低級アルキレン基)を示す。）又は状は〔化26〕で示される基を示し、R⁴ が上記〔化27〕で示される基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基-O-A₄-CO-NR⁴⁰R⁴¹（A₄は低級アルキレン基を示す。R⁴⁰及びR⁴¹は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。またR⁴⁰及びR⁴¹は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5員又は6員の飽和複素環を形成してもよい。）、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及

び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基；アルケニル基；シクロアルキル低級アルキル基；ナフチル低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基；フェノキシ置換低級アルキル基；上記〔化28〕で示される基；基- A_5 - $CR^{42}R^{43}R^{44}$ （式中 A_5 は低級アルキレン基を示す。 R^{42} 及び R^{43} は一緒になって基=O、基=N-OH又は低級アルキレンジオキシ基を形成するものとする。 R^{44} はフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニル基を示す。）；2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキソ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基又は上記〔化34〕で示される基を示し、m、n及びrは前記に同じである一般式（1）で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0621】(509) R^1 が水素原子を示し、 R^2 が水素原子、フェニル基、モルホリノ置換低級アルキル基又はイミダゾリル置換低級アルキル基を示し、 R^3 及び R^4 はこれらが結合する窒素原子と共に結合して形成される1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル基（この複素環上には置換基として低級アルコキシ基を有していてもよい）であり、m、n及びrは前記に同じである一般式（1）で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0622】(510) R^1 がハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基を示し、 R^2 が置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基を示し、 R^3 が水素原子、低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基又は低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 が上記〔化28〕で示される基又は上記〔化34〕で示される基を示し、m、n及びrは前記に同じである一般式（1）で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0623】(511) R^1 がハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基を示し、 R^2 が置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基を示し、 R^3 が水素原子、低級アルキル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基、低級アル

コキシカルボニル基又は低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基を示し、 R^4 が上記〔化27〕で示される基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基- $O-A_4$ - $CO-NR^{40}R^{41}$ （ A_4 は低級アルキレン基を示す。 R^{40} 及び R^{41} は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。また R^{40} 及び R^{41} は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5員又は6員の飽和複素環を形成してもよい。）、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基；アルケニル基；シクロアルキル低級アルキル基；ナフチル低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基；フェノキシ置換低級アルキル基；基- A_5 - $CR^{42}R^{43}R^{44}$ （式中 A_5 は低級アルキレン基を示す。 R^{42} 及び R^{43} は一緒になって基=O、基=N-OH又は低級アルキレンジオキシ基を形成するものとする。 R^{44} はフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニル基を示す。）又は2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキソ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基を示し、m、n及びrは前記に同じである一般式（1）で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0624】(512) R^1 がハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基を示し、 R^2 が置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基を示し、 R^3 がフェニル低級アルコキシカルボニル基；低級アルカノイル基；低級アルコキシ低級アルキル基；フェノキシカルボニル基；低級アルカノイル基置換低級アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基；基-E- $R^{52}R^{53}$ （ R^{52} 及び R^{53} は、同一又は異なって水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基又はフェニル基を示す。 R^{52} 及び R^{53} は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸

素原子を介し又は介することなく互いに結合して5員又は6員環の飽和複素環を形成してもよい。Eは低級アルキレン基、基-C(=O)-又は基-C(=O)-A-(Aは低級アルキレン基)を示す。)又は又はは〔化26〕で示される基を示し、R⁴が上記〔化27〕で示される基;フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基-O-A₄-CO-NR⁴⁰R⁴¹(A₄は低級アルキレン基を示す。R⁴⁰及びR⁴¹は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。またR⁴⁰及びR⁴¹は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5員又は6員の飽和複素環を形成してもよい。)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基;アルケニル基;シクロアルキル低級アルキル基;ナフチル低級アルキル基;フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基;フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基;フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基;フェノキシ置換低級アルキル基;上記〔化28〕で示される基;基-A₅-CR⁴²R⁴³R⁴⁴(式中A₅は低級アルキレン基を示す。R⁴²及びR⁴³は一緒になって基=O、基=N-OH又は低級アルキレンジオキシ基を形成するものとする。R⁴⁴はフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニル基を示す。);2,3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキシ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2,3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基又は上記〔化34〕で示される基を示し、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0625】(513) R¹がハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基を示し、R²が置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基を示し、R³及びR⁴はこれらが結合する窒素原子と共に結合して形成される1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリル基(この複素環上には置換基として低級アルコキシ基を有していてもよい)であり、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

ノキサリン誘導体又はその塩。

【0626】(514) R¹がハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基を示し、R²が水素原子、フェニル基、モルホリノ置換低級アルキル基又はイミダゾリル置換低級アルキル基を示し、R³が水素原子、低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基又は低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基を示し、R⁴が上記〔化28〕で示される基又は上記〔化34〕で示される基を示し、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0627】(515) R¹がハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基を示し、R²が水素原子、フェニル基、モルホリノ置換低級アルキル基又はイミダゾリル置換低級アルキル基を示し、R³が水素原子、低級アルキル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基又は低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基を示し、R⁴が上記〔化27〕で示される基;フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基-O-A₄-CO-NR⁴⁰R⁴¹(A₄は低級アルキレン基を示す。R⁴⁰及びR⁴¹は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。またR⁴⁰及びR⁴¹は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5員又は6員の飽和複素環を形成してもよい。)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基;アルケニル基;シクロアルキル低級アルキル基;ナフチル低級アルキル基;フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基;フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基;フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基;フェノキシ置換低級アルキル基;基-A₅-CR⁴²R⁴³R⁴⁴(式中A₅は低級アルキレン基を示す。R⁴²及びR⁴³は一緒になって基=O、基=N-OH又は低級アルキレンジオキシ基を形成するものとする。R⁴⁴はフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのある

フェニル基を示す。)又は2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキシ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基を示し、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0628】(516) R^1 がハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基を示し、 R^2 が水素原子、フェニル基、モルホリノ置換低級アルキル基又はイミダゾリル置換低級アルキル基を示し、 R^3 がフェニル低級アルコキシカルボニル基；低級アルカノイル基；低級アルコキシ低級アルキル基；フェノキシカルボニル基；低級アルカノイル基置換低級アルキル基；フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基；基-E- R^{52} R^{53} (R^{52} 及び R^{53} は、同一又は異なって水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基又はフェニル基を示す。 R^{52} 及び R^{53} は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5員又は6員環の飽和複素環を形成してもよい。Eは低級アルキレン基、基-C(=O)-又は基-C(=O)-A-(Aは低級アルキレン基)を示す。)又は状は〔化26〕で示される基を示し、 R^4 が上記〔化27〕で示される基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基-O-A₄-CO-NR⁴⁰R⁴¹ (A₄は低級アルキレン基を示す。 R^{40} 及び R^{41} は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。また R^{40} 及び R^{41} は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5員又は6員の飽和複素環を形成してもよい。)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基；アルケニル基；シクロアルキル低級アルキル基；ナフチル低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基；フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基；フェノキシ置換低級アルキル基；上記〔化28〕で示される基；基-

A₅-CR⁴²R⁴³R⁴⁴ (式中A₅は低級アルキレン基を示す。 R^{42} 及び R^{43} は一緒になって基=O、基=N-OH又は低級アルキレンジオキシ基を形成するものとする。 R^{44} はフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニル基を示す。); 2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキシ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2, 3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基又は上記〔化34〕で示される基を示し、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0629】(517) R^1 がハロゲン原子、低級アルキル基、低級アルコキシ基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基又は置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基を示し、 R^2 が水素原子、フェニル基、モルホリノ置換低級アルキル基又はイミダゾリル置換低級アルキル基を示し、 R^3 及び R^4 はこれらが結合する窒素原子と共に結合して形成される1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル基(この複素環上には置換基として低級アルコキシ基を有していてもよい)であり、m、n及びrは前記に同じである一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0630】(518) 上記〔化28〕で示される基中の〔化29〕で示される飽和又は不飽和複素環置換低級アルキル基の飽和又は不飽和複素環部分がベンゾフリル、ベンゾチエニル、インドリル、2, 3-ジヒドロベンゾフリル、ペルヒドロベンゾフリル、キノリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾチアゾリル、イミダゾ〔1, 2-a〕ピリジル、1, 4-ベンゾジオキサニル、フロ〔3, 2-c〕ピリジル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロフロ〔2, 3-g〕キノリル、フロ〔2, 3-g〕キノリル、3, 4-ジヒドロフロ〔2, 3-g〕キノリル、チアゾリル、ピリジル、フリル、イミダゾリル、1, 2, 3, 4-テトラゾリル又はオキサゾリル基である上記(502)、(504)、(506)、(508)、(510)、(512)、(514)、(516)に記載の一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0631】(519) 上記〔化28〕で示される基中の〔化29〕で示される飽和又は不飽和複素環置換低級アルキル基の飽和又は不飽和複素環部分がベンゾフリル又はオキサゾリル基である上記(502)、(504)、(506)、(508)、(510)、(512)、(514)、(516)に記載の一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0632】(520) 上記〔化34〕で示される基中の〔化35〕で示される飽和又は不飽和複素環置換低級アルケニル基の飽和又は不飽和複素環部分がベンゾフリル、ベンゾチエニル、カルボスチリル、3, 4-ジヒドロカルボスチリル、フロ〔3, 2-c〕ピリジル、1,

2, 3, 4-テトラヒドロフロ〔2, 3-g〕キノリル、フロ〔2, 3-g〕キノリル、3, 4-ジヒドロフロ〔2, 3-g〕キノリル、ナフト〔2, 1-b〕フリル又はオキサゾリル基である上記(502)、(504)、(506)、(508)、(510)、(512)、(514)、(516)に記載の一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0633】(521) 上記〔化34〕で示される基中の〔化35〕で示される飽和又は不飽和複素環置換低級アルケニル基の飽和又は不飽和複素環部分がベンゾフリル基である上記(502)、(504)、(506)、(508)、(510)、(512)、(514)、(516)に記載の一般式(1)で示されるキノキサリン誘導体又はその塩。

【0634】(522) 2-〔3-(ベンゾフラン-2-イル)-2-ブテニルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシド、2-〔(3-メチル-7-トリフルオロメチルベンゾフラン-2-イル)メチルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシド、2-〔(2-フェニル-5-メチルオキサゾール-4-イル)メチルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシド、2-〔5-(2, 5-ジメチルチアゾール-4-イル)ベンゾフラン-3-イル〕メチルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシド、2-〔3-〔5-(2-メチル-1, 2, 3, 4-テトラゾール-5-イル)ベンゾフラン-2-イル〕-2-ブテニルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシド、2-〔5-(ベンゾフラン-2-イル)-2, 4-ヘキサジエニルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシド、2-〔3-〔5-(2, 5-ジメチルチアゾール-4-イル)ベンゾフラン-2-イル〕-2-ブテニルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシド、2-〔3-〔5-(チアゾール-2-イル)ベンゾフラン-2-イル〕-2-ブテニルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシド、2-〔3-(5, 7-ジフルオロベンゾフラン-2-イル)-2-ブテニルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシド、2-〔N-〔3-(ベンゾフラン-2-イル)-2-ブテニル〕-N-メトキシカルボニルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシド、2-〔N-〔3-(ベンゾフラン-2-イル)-2-ブテニル〕-N-プロパノイルオキシメチルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシド、2-〔N-〔3-(ベンゾフラン-2-イル)-2-ブテニル〕-N-アセチルオキシメチルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシド、2-〔N-〔3-(ベンゾフラン-2-イル)-2-ブテニル〕-N-エトキシカルボニルアミノカルボニル〕

-3-メチルキノキサリン-4-オキシド、2-〔N-〔(3-メチル-7-トリフルオロメチルベンゾフラン-2-イル)メチル〕-N-アセトキシメチルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシド及び2-〔N-〔(2-フェニル-5-メチルオキサゾール-4-イル)メチル〕-N-アセトキシメチルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシドからなる群より選ばれたキノキサリン誘導体又はその塩。

【0635】本発明の化合物には、m及びnが同時に1を示す化合物、mが1、nが0の化合物、mが0、nが1の化合物、m及びnが同時に0の化合物が含まれるが、mが1、nが0の化合物が特に好ましい。

【0636】上記〔化29〕で示される基の複素環基としては、ビリジル、チアゾリル、フリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾチアゾリル、オキサゾリル、キノリル、インドリル、1, 4-ベンゾジオキサニル、3, 4-ジヒドロフロ〔2, 3-g〕キノリル、1, 2, 3, 4-テトラヒドロフロ〔2, 3-g〕キノリル、フロ〔3, 2-c〕ビリジル、フロ〔2, 3-g〕キノリル、ベンゾフリル、ベンゾチエニル、2, 3-ジヒドロベンゾフリル、ベルヒドロベンゾフリル、イミダゾリル、1, 2, 3, 4-テトラゾリル、イミダゾ〔1, 2-a〕ビリジル基等が特に好ましい。

【0637】上記〔化31〕で示される基の複素環基としては、1, 2, 3, 4-テトラゾリル、チアゾリル、ビリジル、オキサゾリル、1, 2, 3, 5-オキサチアジアゾリル、1, 3, 4-トリアゾリル、1, 2, 4-オキサジアゾリル、1, 2, 4-トリアジニル、イミダゾリル、1, 3, 4-オキサジアゾリル、ピリミジニル、1, 2, 3, 4-テトラゾリル基等が特に好ましい。

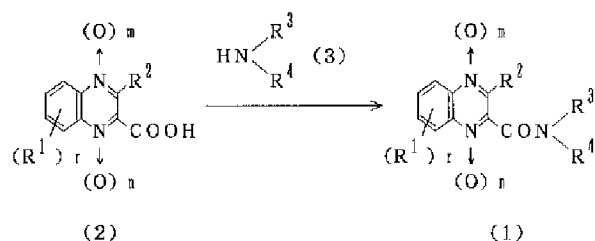
【0638】上記〔化33〕で示される基の複素環基としては、チアゾリル、1, 2, 3, 4-テトラゾリル、チアゾリジニル基等が特に好ましい。

【0639】上記〔化35〕で示される基の複素環基としては、ベンゾフリル、ベンゾチアゾリル、カルボスチリル、3, 4-ジヒドロカルボスチリル、フロ〔3, 2-c〕ビリジル、ベンゾチエニル、ナフト〔2, 1-b〕フリル、オキサゾリル、フロ〔2, 3-g〕キノリル、3, 4-ジヒドロフロ〔2, 3-g〕キノリル基等が特に好ましい。

【0640】上記一般式(1)で表わされる本発明の化合物は、種々の方法により製造されるが、その好ましい一例を挙げれば例えば下記に示す方法により製造される。

【0641】
〔化37〕

反応式-1



【0642】〔式中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 r 、 m 及び n は前記に同じ。〕

化合物(2)と化合物(3)との反応は、通常のアミド結合生成反応に従って実施される。アミド結合生成反応は、公知の各種方法、例えば(イ)混合酸無水物法、例えばカルボン酸(2)にハロカルボン酸アルキルエステルを反応させて混合酸無水物とし、これにアミン(3)を反応させる方法；(ロ)活性エステル法、例えばカルボン酸(2)を

-

ニトロフェニルエステル、

N

-ヒドロキシコハク酸イミドエステル、

1

-ヒドロキシベンゾトリアゾールエステル等の活性エステルとし、これにアミン(3)を反応させる方法；(ハ)カルボジイミド法；即ちカルボン酸(2)にアミン(3)をジシクロヘキシルカルボジイミド、カルボニルジイミダゾール等の活性剤の存在下に縮合させる方法；(ニ)その他の方法、例えばカルボン酸(2)を無水酢酸等の脱水剤により、カルボン酸無水物とし、これにアミン(3)を反応させる方法、カルボン酸(2)と低級アルコールとのエステルにアミン(3)を反応させる方法、カルボン酸(2)の酸ハロゲン化物、即ちカルボン酸ハライドにアミン(3)を反応させる方法等により実施することができる。またカルボン酸(2)をトリフェニルホスフィンやジエチルクロロホスファート等のリン化合物で活性化し、これにアミン(3)を反応させる方法、更にカルボン酸(2)をホスゲン又はクロロホルム酸トリクロロメチルエステル等により

N

-カルボキシアミノ酸無水物とした後、これとアミン(3)を反応させる方法等によることもできる。また更にカルボン酸(2)をトリメチルシリルエトキシアセチレン等のアセチレン化合物で活性化し、これにアミン(3)を反応させる方法等によることもできる。

【0643】上記(イ)に示す混合酸無水物法において、使用される混合酸無水物は通常のジョッテン-バウマン反応により得られ、これを通常単離することなくアミン(3)と反応させることにより、一般式(1)の化合物が製造される。ジョッテン-バウマン反応は塩基性化合物の存在下に行なわれる。用いられる塩基性化合物としては、ジョッテン-バウマン反応に慣用の化合物が用いられ、例えばトリエチルアミン、トリメチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、

N

-メチルモルホリン、

4

-ジメチルアミノピリジン、

1

、

5

-ジアザビシ

クロ〔

4

、

3

、

0

〕ノネン-

5

(DBN)、

1

、

8

-ジアザビシクロ〔

5

、

4

、

0

〕ウンデセン-

7

(DBU)、

1

、

4

-ジアザビシクロ〔

2

、

2

、

2

〕オクタン(DABCO)等の有機塩基、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基等を例示できる。該反応は、約-

20

~

100

°C、好ましくは

0

~

50

°Cにおいて約5分~

10

時間、好ましくは5分~

2

時間程度で行なわれる。得られた混合酸無水物とアミン(3)との反応は、約-

20

~

150

°C、好ましくは

10

~

50

°Cにおいて約5分~

10

時間、好ましくは約5分~

5

時間程度を要して行なわれる。また上記混合酸無水物は、一般にこの種混合酸無水物法に慣用の溶媒、具体的には塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、

1

、

1

、

3

、

3

-テトラメチルウレア、

N

、

N

-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチルリン酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒等の適当な溶媒もしくは混合溶媒中又は非存在下で行なわれる。尚、上記混合酸無水物の製造において使用されるハロカルボン酸アルキルエステルとしては、クロロ蟻酸メチル、ブromo蟻酸メチル、クロロ蟻酸エチル、ブromo蟻酸エチル、クロロ蟻酸イソブチル等を例示できる。ハロカルボン酸アルキルエステルは通常アミン(3)に対し少なくとも等モル量、好ましくは約

1

~

1.5

倍モル量用いられる。またアミン(3)の使用量は、通常カルボン酸(2)に対して少なくとも等モル量、好ましくは約

1

~

1.5

倍モルとするのが好ましい。

【0644】上記(ロ)に示す活性エステル法は、例えば

N

-ヒドロキシコハク酸イミドエステルを用いる場合を例にとれば、反応に影響を与えない適当な溶媒中塩基性化合物の存在下又は非存在下に行なわれる。また該反応の反応系内にはジシクロヘキシルカルボジイミド、カルボニルジイミダゾール、

1

-エチル-

3

-(

3

'-ジメチルアミノプロピル)カルボジイミド等の縮合剤を添加してもよい。ここで塩基性化合物としては、前記ジョッテン-バウマン反応に用いられる塩基性化合物をいづれも使用可能であり、それらに加えて酢酸ナトリウム、

安息香酸ナトリウム、ギ酸ナトリウム、酢酸カリウム、安息香酸リチウム、酢酸セシウム等のカルボン酸アルカリ金属塩、フッ化カリウム、フッ化セシウム等のハロゲン化アルカリ金属塩等をも使用可能である。また溶媒としては、具体的には塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジメチルシエタン等のエーテル類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、N、N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチルリン酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒等又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。反応は、通常0～150℃、好ましくは10～100℃で、5～30時間で終了する。アミン(3)とN-ヒドロキシコハク酸イミドエステルとの使用割合は、化合物(2)に対して通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～2倍モルとするのが望ましい。

【0645】またアミン(3)とカルボン酸(2)とを、トリフェニルホスフィン、トリフェニルホスフィン-2, 2'-ジビリジルスルフィド、ジエチルクロロホスファート、ジフェニルホスフィニルクロリド、フェニル-N-フェニルホスホラミドクロリド、シアノリン酸ジエチル、ビス(2-オキソ-3-オキサゾリジン)ホスフィニルクロリド等のリン化合物の縮合剤の存在下に反応させることによっても、化合物(1)を得ることができる。ここで使用される塩基性化合物としては、公知のものを広く使用でき、例えば前記シュotten-バウマン反応に用いられる塩基性化合物の他に水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等を挙げることができる。溶媒としては、前記混合酸無水物法に用いられる溶媒の他、例えばピリジン、アセトン、アセトニトリル等又は上記溶媒の二種以上の混合溶媒等を挙げることができる。該反応は、通常-20～150℃程度、好ましくは0～100℃付近にて行なわれ、一般に5分～30時間にて反応は終了する。縮合剤及びアミン(3)の使用量は、カルボン酸(2)に対して、それぞれ少なくとも等モル程度、好ましくは等モル～2倍モル程度とするのがよい。

【0646】またアミン(3)とカルボン酸(2)とを縮合剤の存在下に反応させることによっても化合物(1)を得ることができる。該反応は、適当な溶媒中、触媒の存在下又は非存在下に行なわれる。ここで使用される溶媒としては、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル、ジメチルホルムアミド等を例示できる。使用される触媒としては、ジメチルアミノピリジン、4-ピペリジノピリジン等の有機塩基、ピリジニウムトシラート等の塩、カンファースルホン酸、酸化水銀等を例示できる。縮合剤としては、例えばトリメチルシリルエトキシアセチレン等のアセチレン化合物が挙げら

れる。縮合剤は、アミン(3)に対して通常等モル～10倍モル量、好ましくは2～6倍モル量用いるのがよい。またカルボン酸(2)は、アミン(3)に対して通常少なくとも等モル程度、好ましくは等モル～2倍モル程度用いるのがよい。該反応は、通常0～150℃程度、好ましくは室温～100℃付近にて行なわれ、一般には1～10時間程度にて反応は終了する。

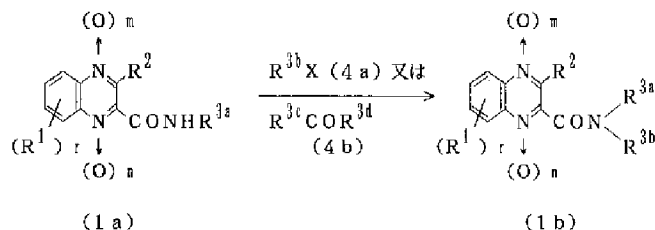
【0647】上記(二)に示す、カルボン酸ハライドにアミン(3)を反応させる方法を採用する場合、該反応は脱ハロゲン化水素剤の存在下適当な溶媒中で行なわれる。この脱ハロゲン化水素剤としては通常の塩基性化合物が用いられる。塩基性化合物としては公知のものを広く使用でき、例えばシュotten-バウマン反応に用いられる塩基性化合物の他に、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム等を挙げることができる。溶媒としては前記混合酸無水物法に用いられる溶媒の他、例えばメタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、3-メトキシ-1-ブタノール、エチルセロソルブ、メチルセロソルブ等のアルコール類、ピリジン、アセトン、アセトニトリル又は上記溶媒の二つ以上の混合溶媒等を挙げることができる。カルボン酸ハライドとアミン(3)との使用割合は特に限定されず広範囲内で適宜選択されるが、通常前者に対して後者を少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル～5倍モル量程度用いるのがよい。該反応は、通常-20～180℃程度、好ましくは約0～150℃で行なわれ、一般に約5分～30時間で反応は完結する。

【0648】上記においてカルボン酸ハライドは、例えばカルボン酸(2)とハロゲン化剤とを無溶媒下又は溶媒の存在下に反応させることにより製造される。溶媒としては、反応に悪影響を与えないものであれば使用でき、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、クロロホルム、塩化メチレン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル等のエーテル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等が挙げられる。ハロゲン化剤としては、カルボキシ基の水酸基をハロゲンに変える、通常のハロゲン化剤を使用でき、例えば塩化チオニル、オキシ塩化リン、オキシ臭化リン、五塩化リン、五臭化リン等が例示される。カルボン酸(2)とハロゲン化剤との使用割合は特に限定されず適宜選択されるが、無溶媒下で反応を行なう場合には、通常前者に対して後者を大過剰量、また溶媒中で反応を行なう場合には、通常前者に対して後者を少なくとも等モル量程度、好ましくは2～4倍モル量を用いる。その反応温度及び反応時間も特に限定されないが、通常室温～100℃程度、好ましくは50～80℃にて、30分間～6時間程度で行なわれる。

【0649】上述のカルボン酸(2)と低級アルコールとのエステルにアミン(3)を反応させる方法を採用す

る場合、該反応は、適当な溶媒中又は無溶媒下に行なわれる。ここで使用される溶媒としては、前記カルボン酸ハライドとアミンとの反応で用いられる溶媒をいずれも使用することができる。アミン(3)は、カルボン酸(2)と低級アルコールとのエステルに対して、通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～1.5倍モル量使用

反応式-2



【0651】〔式中 R^1 、 R^2 、 r 、 m 及び n は前記に同じ。Xはハロゲン原子を示す。 R^{3a} は水素原子、低級アルキル基、フェニル低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基、低級アルコキシ低級アルキル基、フェノキシカルボニル基、低級アルカノイル基置換低級アルキル基、低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基、基-E- $R^{52}R^{53}$ (R^{52} 及び R^{53} は、同一又は異なって水素原子、低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル基又はフェニル基を示す。 R^{52} 及び R^{53} は、これらが結合する窒素原子と共に他の窒素原子もしくは酸素原子を介し又は介することなく互いに結合して5員又は6員環の飽和複素環を形成してもよい。Eは低級アルキレン基、基-C(=O)-又は基-C(=O)-A-(Aは低級アルキレン基)を示す。)、上記〔化26〕で示される基、上記〔化27〕で示される基、フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基-O-A₄-CO-NR⁴⁰R⁴¹ (A₄、 R^{40} 及び R^{41} は前記に同じ。)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基、アルケニル基、シクロアルキル低級アルキル基、ナフチル低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフ

するのがよい。該反応は、通常室温～150℃、好ましくは室温～120℃付近にて、1～20時間程度にて終了する。

【0650】

【化38】

エニルスルホニル置換低級アルキル基、フェノキシ置換低級アルキル基、上記〔化28〕で示される基、基-A₅-C $R^{42}R^{43}R^{44}$ (式中A₅、 R^{42} 、 R^{43} 及び R^{44} は前記に同じ。)、2,3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキソ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2,3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基又は上記〔化34〕で示される基を示す。 R^{3b} は、水素原子以外の前記 R^{3a} を示す。 R^{3c} 及び R^{3d} はそれぞれ水素原子又は低級アルキル基を示す。〕

一般式(1a)の化合物と一般式(4a)の化合物との反応は、一般に適当な不活性溶媒中、塩基性化合物の存在下又は不存在下にて行なわれる。用いられる不活性溶媒としては例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジエチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール等の低級アルコール類、酢酸エチル、アセトン、アセトニトリル、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミド、ヘキサメチルリン酸トリアミド等又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。また塩基性化合物としては例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等の金属水酸化物、水素化ナトリウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート、ピリジン、N-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、DBN、DBU、DABCO等の有機塩基等を挙げることができる。一般式(1a)の化合物と一般式(4a)の化合物との使用割合としては、特に限定がなく広い範囲で適宜選択すればよいが、前者に対して後者を少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル～10倍モル量程度用いるのがよい。該反応は通常0～200℃程度、好まし

くは0～170℃程度にて行なわれ、一般に30分～30時間程度で反応は終了する。該反応系内には沃化ナトリウム、沃化カリウム等のアルカリ金属ハロゲン化合物等を添加してもよい。また沃化テトラ-n-ブチルアンモニウム、臭化テトラ-n-ブチルアンモニウム、沃化-n-ブチル・トリエチルアンモニウム、沃化テトラエチルアンモニウム、沃化トリ-n-ブチル・メチルアンモニウム等のハロゲン化アンモニウム等を添加してもよい。

【0652】化合物(1a)と化合物(4b)の反応は、無溶媒又は適当な溶媒中、還元剤の存在下に行なわれる。ここで使用される溶媒としては例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、アセトニトリル、ギ酸、酢酸、ジオキサン、ジエチルエーテル、ジグライム、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類又はこれらの混合溶媒等を例示できる。還元剤としては例えばギ酸、ギ酸ナトリウム等の脂肪酸アルカリ金属塩、水素化硼素ナトリウム、水素化シアノ硼素ナトリウム、水素化アルミニウムリチウム等の水素化還元剤、パラジウム-黒、パラジウム-炭素、酸化白金、白金黒、ラーネーニッケル等の接触還元剤等を例示できる。

【0653】還元剤としてギ酸を使用する場合、反応温度は通常室温～200℃程度、好ましくは50～150℃程度付近が適当であり、反応は1～10時間程度にて終了する。ギ酸の使用量は化合物(1a)に対して大過

剰量使用するのがよい。

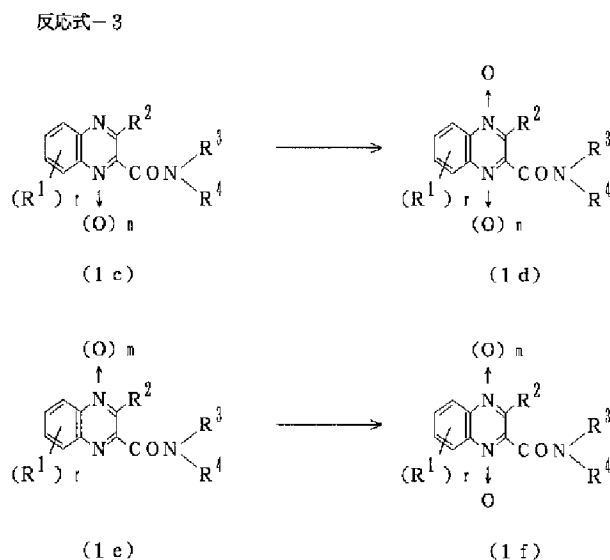
【0654】また水素化還元剤を使用する場合、反応温度は通常-30～100℃程度、好ましくは0～70℃程度が適当であり、30分～15時間程度で反応は完結する。還元剤の使用量は、化合物(1a)に対して通常等モル～20倍モル量程度、好ましくは1～6倍モル量程度とするのがよい。特に還元剤として水素化アルミニウムリチウムを使用する場合、溶媒としてジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類を使用するのが好ましい。

【0655】更に接触還元剤を用いる場合は、通常常圧～20気圧程度、好ましくは常圧～10気圧程度の水素雰囲気中で、又はギ酸、ギ酸アンモニウム、シクロヘキセン、抱水ヒドラジン等の水素供与剤の存在下で、通常-30～100℃程度、好ましくは0～60℃程度の温度で反応を行なうのがよく、通常1～12時間程度で反応は終了する。接触還元剤の使用量としては化合物(1a)に対して通常0.1～40重量%、好ましくは1～20重量%程度とするのがよい。

【0656】化合物(4b)の使用量としては化合物(1a)に対して通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～大過剰量とするのがよい。

【0657】

【化39】



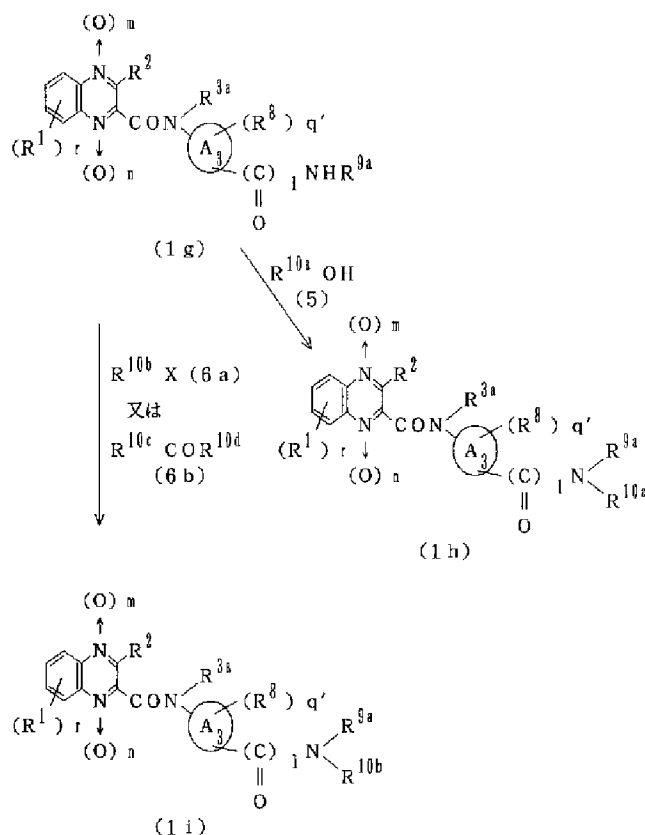
【0658】〔式中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 r 、 m 及び n は前記に同じ。〕

化合物(1c)を化合物(1d)に導く反応及び化合物(1e)を化合物(1f)に導く反応は、いずれも適当な溶媒中酸化剤の存在下に行なわれる。ここで使用される溶媒としては、例えば水、ギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸、メタノール、エタノール等のアルコ-

ール類、クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類又はこれらの混合溶媒等を例示できる。使用される酸化剤としては、例えば過ギ酸、過酢酸、過トリフルオロ酢酸、過安息香酸、 m -クロロ過安息香酸、 o -カルボキシ過安息香酸等の過酸、過酸化水素、メタ過沃素酸ナトリウム、重クロム酸、重クロム酸ナトリウム、重クロム酸カリウム等の重クロム酸塩、過マンガ酸、

過マンガン酸カリウム、過マンガン酸ナトリウム等の過マンガン酸塩、四酢酸鉛等の鉛塩等が挙げられる。酸化剤は、通常出発原料に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル～2倍モル量使用するのがよい。上記反応

反応式-4



【0660】〔式中 R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、 R^8 、上記〔化29〕で示される基、 r 、 m 、 n 、 X 及び l は前記に同じ。 R^{9a} は水素原子、低級アルカノイル基、低級アルキル基、モルホリノカルボニル低級アルキル基、シクロアルキルカルボニル基、フェニル低級アルケニルカルボニル基、低級アルキルスルホニル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニルスルホニル基、フェニル低級アルケニル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子、低級アルコキシ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基及び水酸基なる群より選ばれた基を1～3個有することのあるベンゾイル基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基置換低級アルカノイル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基置換スルホニル基、フェニル低級アルキル基、フェニル基又は置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を示す。 R^{10a} は低級アルカノイル基、シクロアルキルカルボニル基、フェニル低級アルケニルカルボニル基、フェニル環上に置換

基としてハロゲン原子、低級アルコキシ基、置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基及び水酸基なる群より選ばれた基を1～3個有することのあるベンゾイル基又は置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基置換低級アルカノイル基を示す。 R^{10b} は低級アルキル基、モルホリノカルボニル低級アルキル基、低級アルキルスルホニル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノカルボニル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるフェニルスルホニル基、フェニル低級アルケニル基、置換基として低級アルキル基を有することのあるアミノ基置換スルホニル基又はフェニル低級アルキル基を示す。 q' は1又は2を示す。 R^{10c} 及び R^{10d} はそれぞれ水素原子又は低級アルキル基を示す。〕

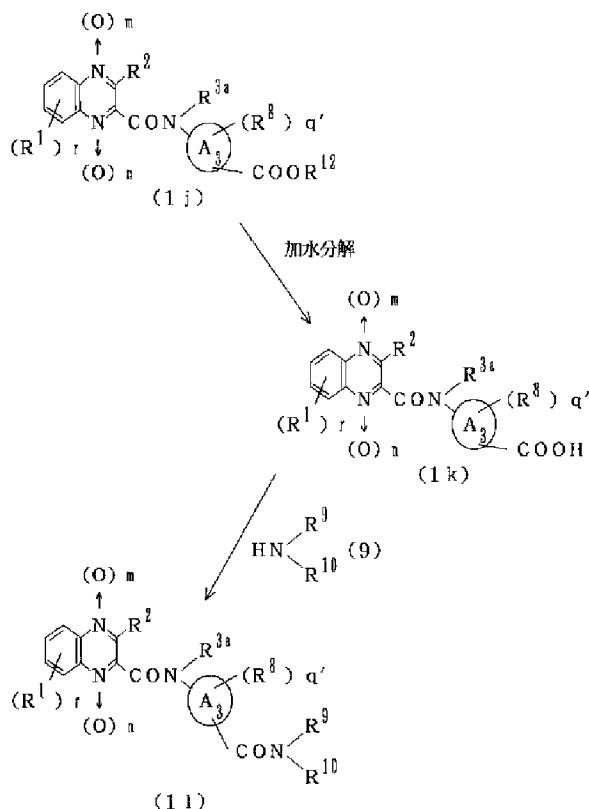
【0659】

【化40】

【0661】化合物(1h)で R^{10a} が低級アルカノイル基である化合物は、一般式 $(R^{11})_2O$ (7)又は一般式 $R^{11}X$ (8)〔上記各式中、 R^{11} は低級アルカノイ

ル基を示す。Xは前記に同じ。〕で表わされる化合物を用いて該化合物(1g)を低級アルカノイル化することによっても誘導され得る。この低級アルカノイル化反応は、塩基性化合物の存在下又は非存在下に行なわれる。使用される塩基性化合物として、例えば金属ナトリウム、金属カリウム等のアルカリ金属及びこれらアルカリ金属の水酸化物、炭酸塩、重炭酸塩、或いはN、N-ジメチルアミノピリジン、ピリジン、ピペリジン等の有機塩基等を挙げることができる。該反応は、無溶媒及び溶媒中のいずれでも進行する。溶媒としては、例えばアセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジエチルエーテル、ジオキサン等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、水、ピリジン等が

反応式-5



【0664】〔式中 R^1 、 R^2 、 R^8 、 R^{3a} 、 m 、 n 、 q' 、 R^9 、 R^{10} 、 r 及び上記〔化29〕で示される基は前記に同じ。 R^{12} は低級アルキル基を示す。〕化合物(1j)の加水分解反応は、適当な溶媒中又は無溶媒下、酸又は塩基性化合物の存在下を実施することができる。用いられる溶媒としては例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、酢酸、ギ酸等の脂肪酸類、ジメチルホルムアミド、これらの混合溶媒等を挙げることができる。酸としては例えば塩酸、硫酸、臭化水

素酸等の鉱酸やギ酸、酢酸、芳香族スルホン酸等の有機酸等を挙げることができる。塩基性化合物としては例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の金属炭酸塩や水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物等を挙げることができる。該反応は通常室温～200℃程度、好ましくは室温～150℃程度にて好適に進行し、一般に10分～25時間程度で終了する。

【0662】化合物(1g)と化合物(6a)又は化合物(6b)との反応は、前記反応式-2における化合物(1a)と化合物(4a)又は化合物(4b)との反応と同様の条件下に行なわれる。

【0663】

【化41】

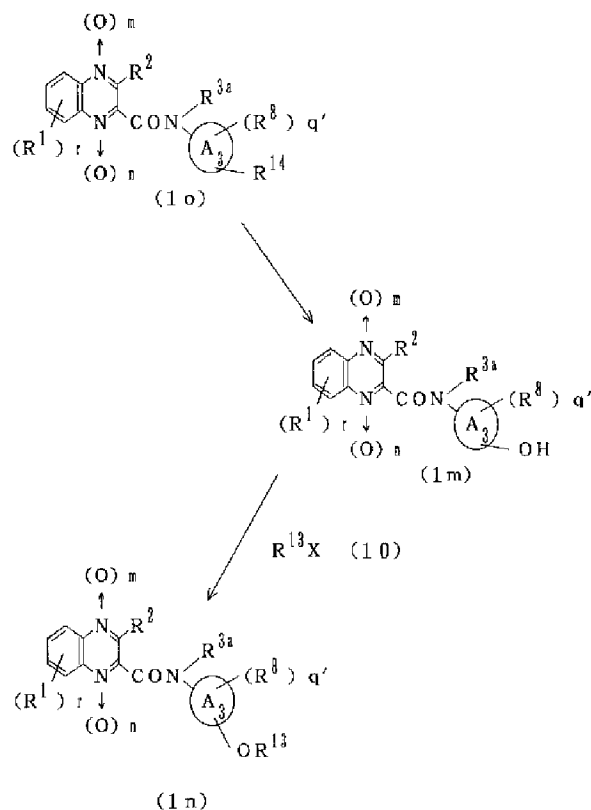
素酸等の鉱酸やギ酸、酢酸、芳香族スルホン酸等の有機酸等を挙げることができる。また塩基性化合物としては例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の金属炭酸塩や水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物等を挙げることができる。該反応は通常室温～200℃程度、好ましくは室温～150℃程度にて好適に進行し、一般に10分～25時間程度で終了する。

【0665】化合物(1k)と化合物(9)との反応は、前記反応式-1における化合物(2)と化合物(3)との反応と同様の条件下に行なわれる。

【0666】

【化42】

反応式-6



【0667】〔式中 R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、 R^8 、 m 、 n 、 q' 、 X 、及び上記〔化29〕で示される基は前記に同じ。 R^{13} は低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を有することのあるフェニル低級アルキル基、カルボキシ置換低級アルキル基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基、低級アルコキシ置換低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルカノイル基又はモルホリノカルボニル低級アルキル基を示す。 R^{14} は低級アルコキシ基、フェニル環上に置換基として低級アルカノイル基を有することのあるアミノ基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基、低級アルカノイルオキシ基又は低級アルコキシ置換低級アルコキシ基を示す。〕

化合物(1o)を化合物(1m)に導く反応は、 R^{14} がフェニル低級アルコキシ基である場合には、化合物(1m)を還元することにより行なわれる。この還元反応は、例えば適当な溶媒中触媒の存在下、接触水素添加することにより行なうことができる。使用される溶媒としては、例えば水、酢酸、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ヘキサン、シクロヘキサン等の炭化水素類、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド等の非プロトン性極性

溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。また使用される触媒としては、例えばパラジウム、パラジウム-黒、パラジウム-炭素、白金、酸化白金、亜クロム酸銅、ランネーニッケル等が挙げられる。触媒の使用量は、化合物(7)に対して一般に0.02~1倍量程度とするのがよい。反応温度は、通常-20~100℃付近、好ましくは0~80℃付近、水素圧は通常1~10気圧とするのがよく、該反応は一般に0.5~20時間程度で終了する。

【0668】また R^{14} が低級アルコキシ基又は低級アルコキシ置換低級アルコキシ基である場合、化合物(1o)を化合物(1m)に導く反応は、化合物(1o)を加水分解することにより行なわれる。該加水分解は、適当な溶媒中酸の存在下に行なわれる。溶媒としては、例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、アセトニトリル等の極性溶媒、これらの混合溶媒等を挙げることができる。酸としては、例えば塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸類、蟻酸、酢酸等の脂肪酸、三弗化硼素、塩化アルミニウム、三臭化硼素等のルイス酸、沃化ナトリウム、沃化カリウム等の沃化物、上記ルイス酸と沃化物の混合物等を挙げることができる。該反応は、通常0~150℃、

好ましくは室温～100℃で好適に進行し、一般に0.5～50時間程度で終了する。

【0669】また、 R^{14} が低級アルカノイルオキシ基である場合、化合物(1o)を化合物(1m)に導く反応は、前記反応式-5における化合物(1j)の加水分解反応と同様の反応条件下に行ない得る。

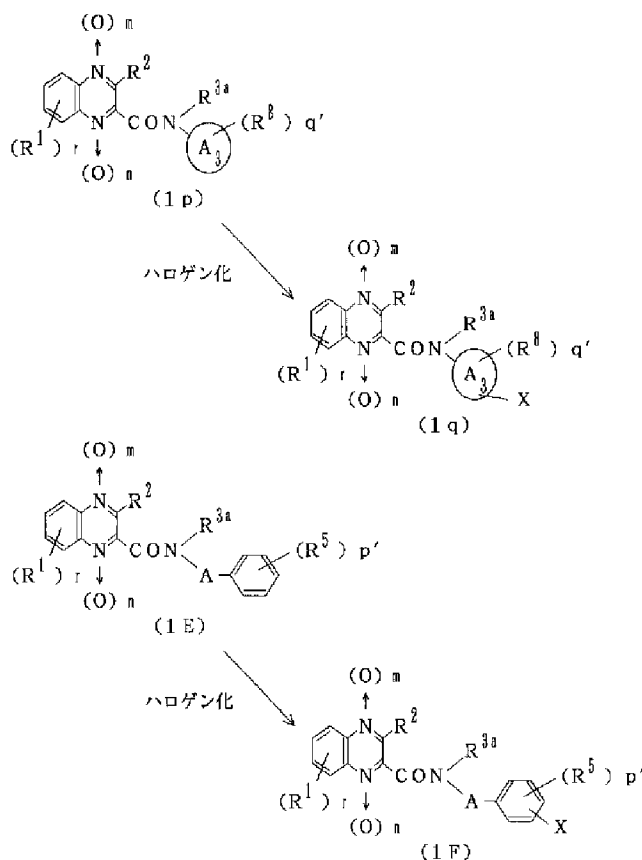
【0670】化合物(1m)と化合物(10)との反応は、前記反応式-4における化合物(1g)と化合物

(6)との反応と同様の条件下に行なわれる。 R^{13} が低級アルカノイル基である化合物(1n)は、化合物(1m)と化合物(7)とを、前記反応式-4における化合物(1g)と化合物(7)との反応と同様の反応条件下に反応させることによって製造され得る。

【0671】

【化43】

反応式-7



【0672】〔式中 R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、 R^5 、 R^8 、 m 、 n 、 q' 、 A 、 X 、 r 及び上記〔化29〕で示される基は前記に同じ。 p' は1又は2を示す。〕

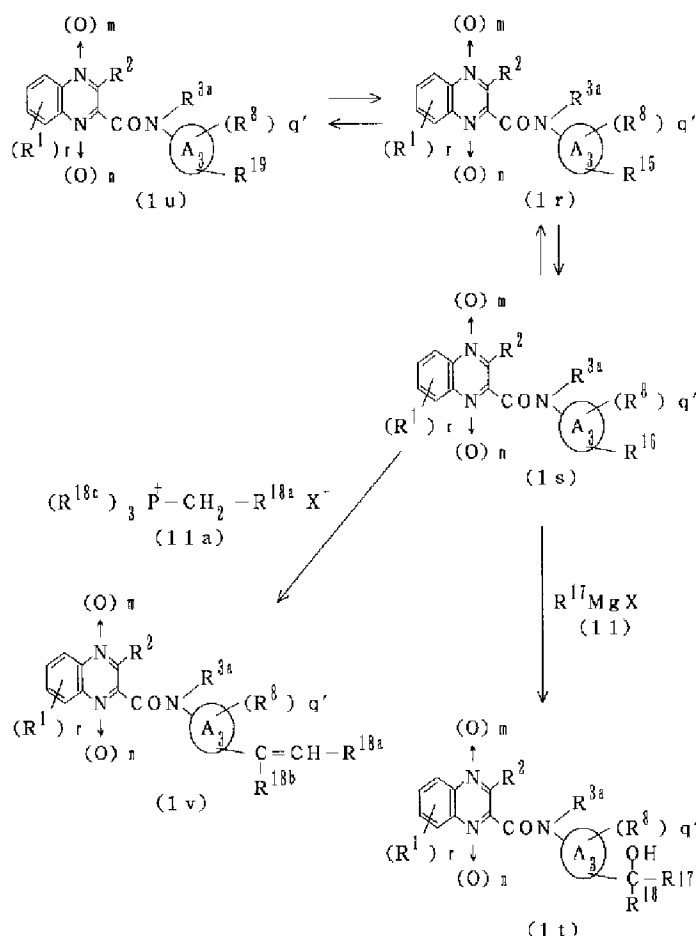
化合物(1p)又は化合物(1E)のハロゲン化反応は、通常ハロゲン化剤の存在下に行なわれる。斯かる反応に使用されるハロゲン化剤としては公知のものを広く使用でき、例えば臭素、塩素等のハロゲン分子又は一塩化炭素、スルフリルクロライド、 N -ブロムコハク酸イミド、 N -クロロコハク酸イミド等の N -ハロゲンコハク酸イミド等のハロゲン化剤を挙げることができる。ハロゲン化剤の使用量としては、通常化合物(1p)又

は化合物(1E)に対して少なくとも等モル量、好ましくは等モル～1.5倍モル量用いるのがよい。該反応に用いられる溶媒は、例えばジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、酢酸、プロピオン酸、水又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。該反応において、反応温度は通常0℃～反応溶媒の沸点、好ましくは0～100℃とするのがよく、通常1～10時間程度で反応は終了する。

【0673】

【化44】

反応式-8



【0674】〔式中 R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、 R^8 、 m 、 n 、 q' 、 X 、 r 及び上記〔化29〕で示される基は前記に同じ。 R^{15} は置換基として水酸基を有する低級アルキル基を示す。 R^{18} は低級アルカノイル基を示す。 R^{17} 及び R^{18} はそれぞれ低級アルキル基を示す。 R^{19} は低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基を示す。 R^{18a} は水素原子又は低級アルキル基を示す。 R^{18c} はフェニル基を示す。 R^{18b} は低級アルキル基を示す。〕

化合物(1r)を化合物(1s)に導く反応は、適当な溶媒中、酸化剤の存在下に行なわれる。ここで使用される酸化剤としては、ピリジニウムクロクロメイト、ピリジニウムジクロクロメイト等のピリジニウムクロム酸塩、ジメチルスルホキシド-オキサリルクロリド、二酸化マンガ、DDQ、重クロム酸、重クロム酸ナトリウム、重クロム酸カリウム等の重クロム酸塩、過マンガ酸、過マンガ酸カリウム、過マンガ酸ナトリウム等の過マンガ酸塩等を例示できる。使用される溶媒としては、例えば、水、ギ酸、酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸、メタノール、エタノール等のアルコール類、クロロホルム、ジクロロメタン等のハロゲン化炭化水素類、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジオキサン等のエーテル類、ジメチルスルホキシド、ジメチルホ

ルムアミド又はこれらの混合溶媒を例示できる。酸化剤は、通常出発原料に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル〜30倍モル量使用するのがよい。反応は、通常0〜150℃程度、好ましくは0〜100℃程度にて、1〜10時間程度にて終了する。

【0675】また化合物(1r)を化合物(1s)に導く反応は、適当な溶媒中、共酸化剤の存在下に化合物(1r)を酸化剤と反応させることによって行なわれる。酸化剤との反応で用いられる溶媒としては、例えばピリジン、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、酢酸エチル等のエステル類、水、メタノール、エタノール、イソプロパノール、n-ブタノール等のアルコール類やこれらの混合溶媒等が挙げられる。使用される共酸化剤としては、例えばピリジンN-オキシド、N-エチルジイソプロピルアミンN-オキシド、N-メチルモルホリンN-オキシド、トリメチルアミンN-オキシド、トリエチルアミンN-オキシド等の有機アミンN-オキシド類等を例示できる。また酸化剤としては、例えばテトラn-プロピルアンモニウムパーテネート等

を例示できる。共酸化剤の使用量としては、原料化合物に対して通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～5倍モル量とするのがよい。また酸化剤の使用量は触媒量使用するのがよい。該反応は、 $-20\sim 150^{\circ}\text{C}$ 、好ましくは $0\sim 100^{\circ}\text{C}$ で行なわれ、一般に1～20時間程度で終了する。該反応系内にモレキュラーシーブスを添加すると反応は有利に進行する。

【0676】化合物(1s)を化合物(1r)に導く反応は、水素化還元剤を用いる還元法が好適に利用される。用いられる水素化還元剤としては、例えば水素化アルミニウムリチウム、ジボラン、水素化ジイソブチルアルミニウム、水素化硼素ナトリウム、水素化硼素リチウム、テトラブチルアンモニウムボロハイドライド、水素化硼素カルシウム、水素化アルミニウム等が挙げられ、その使用量は原料化合物に対して少なくとも0.1倍モル、好ましくは0.1～1.5倍モルの範囲である。この還元反応は、通常適当な溶媒、例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類やこれらの混合溶媒等を用い、通常約 $-60\sim 150^{\circ}\text{C}$ 、好ましくは $-30\sim 100^{\circ}\text{C}$ にて、約10分間～20時間程度で行なわれる。

【0677】化合物(1s)と化合物(11)の反応は、適当な溶媒中で行なわれる。ここで使用される溶媒としては、グリニャール反応で使用される溶媒ならいずれも使用可能であるが、例えばジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル類、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素類、ペンタン、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン等の飽和炭化水素類等を好ましく例示できる。化合物(11)の使用量としては、化合物(1s)に対して通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～2倍モル量とするのがよい。上記反応は通常 $-70\sim 100^{\circ}\text{C}$ 、好ましくは $-30^{\circ}\text{C}\sim 70^{\circ}\text{C}$ 付近にて行なわれ、一般に1～50時間程度で終了する。

【0678】化合物(1r)を化合物(1u)に導く反

応は、前記反応式-4における化合物(1h)と化合物(7)又は化合物(8)との反応と同様の条件下に、化合物(1r)と化合物(7)又は化合物(8)とを反応させることにより行なわれる。

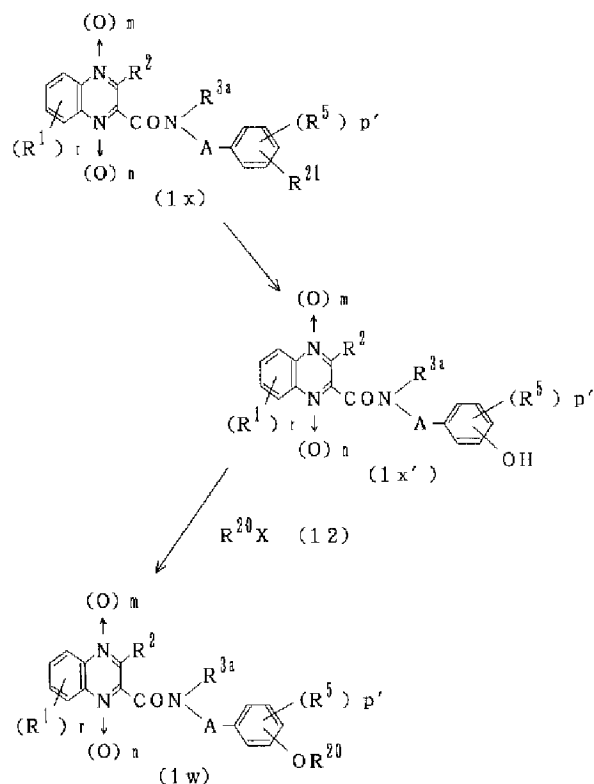
【0679】化合物(1u)を化合物(1r)に導く反応は、前記反応式-5における化合物(1j)の加水分解反応と同様の条件下に行なわれる。

【0680】化合物(1s)と化合物(11a)との反応は、塩基性化合物の存在下、適当な溶媒中で行なわれる。用いられる塩基性化合物としては、金属ナトリウム、金属カリウム、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート、カリウム α -ブトキシド等の金属アルコラート類、メチルリチウム、 n -ブチルリチウム、フェニルリチウム、リチウムジイソプロピルアミド等のアルキル及びアリールリチウム又はリチウムアミド類、ピリジン、ピペリジン、キノリン、トリエチルアミン、 N 、 N -ジメチルアニリン等の有機塩基等を例示できる。溶媒としては、反応に影響を与えないものであればいずれも使用できるが、例えばジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、 n -ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ピリジン、 N 、 N -ジメチルアニリン等のアミン類、 N 、 N -ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチルリン酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類又はこれらの混合溶媒が挙げられる。反応温度は、通常 $-80\sim 150^{\circ}\text{C}$ 、好ましくは $-80\sim 120^{\circ}\text{C}$ 付近とするのがよく、一般に0.5～1.5時間程度で反応は終了する。化合物(11a)の使用量は、化合物(1s)に対して、少なくとも等モル、好ましくは等モル～10倍モル量とするのがよい。

【0681】

【化45】

反応式-9



【0682】〔式中 R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、 R^5 、 m 、 n 、 p' 、 A 、 r 及び X は前記に同じ。 R^{20} は低級アルキル基、低級アルコキシ置換低級アルキル基、低級アルケニル基、低級アルコキシカルボニル置換低級アルキル基、水酸基置換低級アルキル基、カルボキシ置換低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルキル基及び低級アルコキシ基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルキル基、モルホリノ置換低級アルキル基、又は基 $-A_1-CO-NR^6R^7$ (A_1 、 R^6 及び R^7 は前記に同じ。)を示す。 R^{21} は低級アルコキシ基、低級アルコキシ置換低級アルコキシ基又はフェニル環上に置換基として低級アルキル基及び低級アルコキシ基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基を示す。〕

ル環上に置換基として低級アルキル基及び低級アルコキシ基なる群から選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルコキシ基を示す。〕

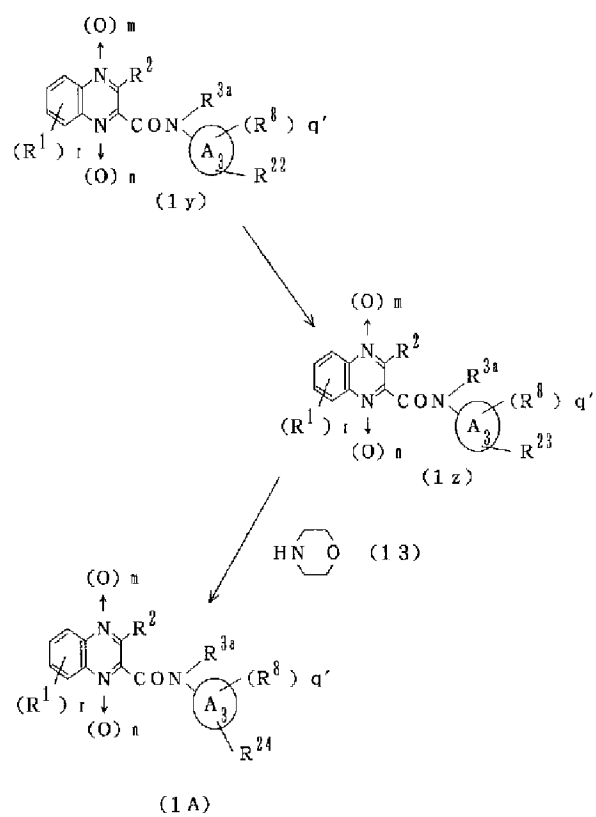
化合物(1x)を化合物(1x')に導く反応は、前記反応式-6における化合物(1o)を化合物(1m)に導く反応と同様の条件下に行なわれる。

【0683】化合物(1x')と化合物(12)との反応は前記反応式-6における化合物(1m)と化合物(10)との反応と同様の条件下に行なわれる。

【0684】

【化46】

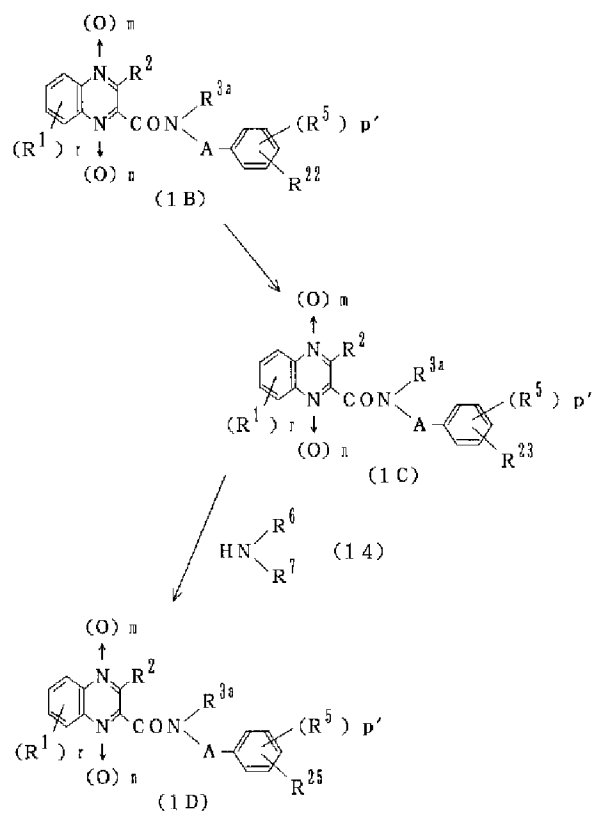
反応式-10a



【0685】

【化47】

反応式-10b



【0686】〔式中 R^1 、 R^{3a} 、 R^8 、 m 、 n 、 q' 、 R^5 、 p' 、 r 及び上記〔化29〕で示される基は前記に同じ。 R^{22} は低級アルコシカルボニル置換低級アルコシ基を示す。 R^{23} はカルボキシ置換低級アルコシ基を示す。 R^{24} はホルホルノカルボニル低級アルコシ基を示す。 R^{25} は基 $-O-A_1-CO-NR^8$ (A_1 、 R^8 及び R^7 は前記に同じ。)を示す。〕
化合物(1y)を化合物(1z)に導く反応及び化合物(1B)を化合物(1C)に導く反応は、前記反応式-

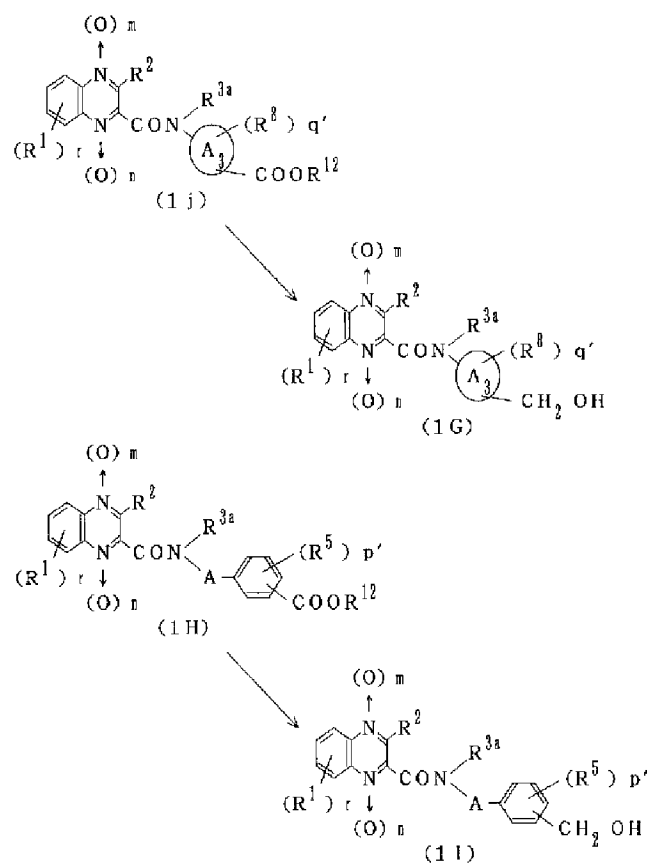
5における化合物(1j)の加水分解反応と同様の条件下に行なわれる。

【0687】化合物(1z)と化合物(13)との反応及び化合物(1C)と化合物(14)との反応は、前記反応式-1における化合物(2)と化合物(3)の反応と同様の条件下に行なわれる。

【0688】

【化48】

反応式-11



【0689】〔式中 R^1 、 R^2 、 R^8 、 R^{3a} 、 m 、 n 、 q' 、 R^{12} 、 R^5 、 p' 、 A 、 r 及び上記〔化29〕で示される基は前記に同じ。〕

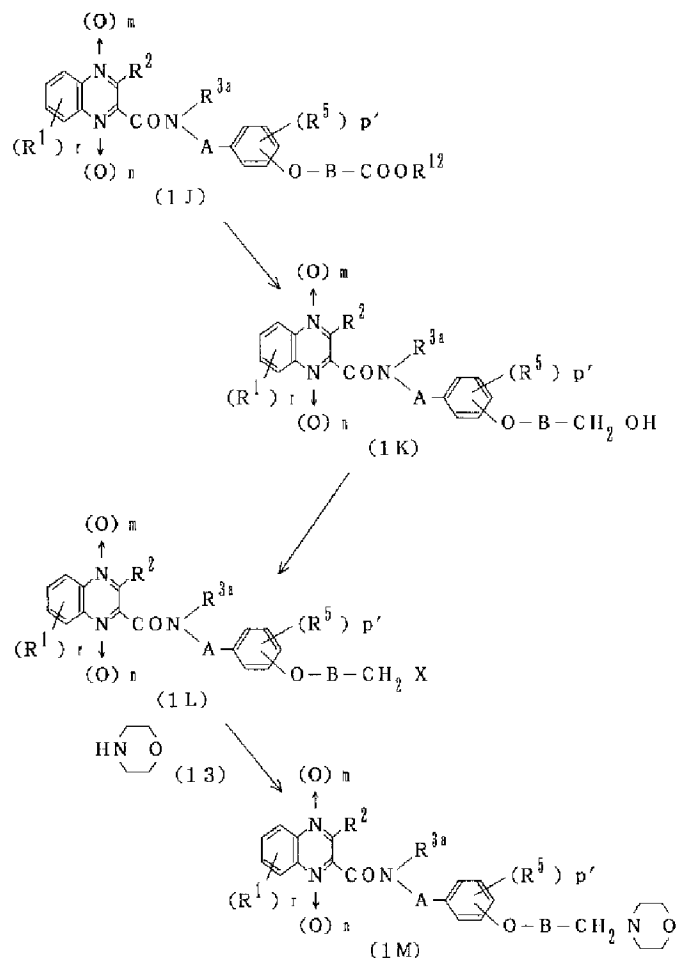
化合物(1j)を化合物(1g)に導く反応及び化合物(1h)を化合物(1i)に導く反応は、前記反応式-

8における化合物(1s)を化合物(1r)に導く反応と同様の条件下に行なわれる。

【0690】

【化49】

反応式-12



【0691】〔式中 R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、 R^5 、 A 、 m 、 n 、 p' 、 R^{12} 、 r 及び X は前記に同じ。 B は低級アルキレン基を示す。〕

化合物(1J)を化合物(1K)に導く反応は、前記反応式-8における化合物(1s)を化合物(1r)に導く反応と同様の条件下に行なわれる。

【0692】化合物(1K)を化合物(1L)に導く反応は、適当な溶媒中又は無溶媒下、化合物(1K)にハロゲン化剤と反応させることにより行なわれる。ここでハロゲン化剤としては、塩酸、臭化水素酸等の鉱酸、 N,N -ジエチル-1,2,2-トリクロロビニルアミド、五塩化リン、五臭化リン、オキシ塩化リン、チオニルクロリド、メシルクロリド又はトシルクロリド等のフェニル低級アルキルハライドと塩基性化合物、四塩化炭素又は四臭化炭素とトリフェニルフォスフィン等を例示できる。ここで塩基性化合物としては、前記反応式-1におけるカルボン酸ハライドとアミンとの反応で例示した塩基性化合物をいずれも使用できる。また、使用され

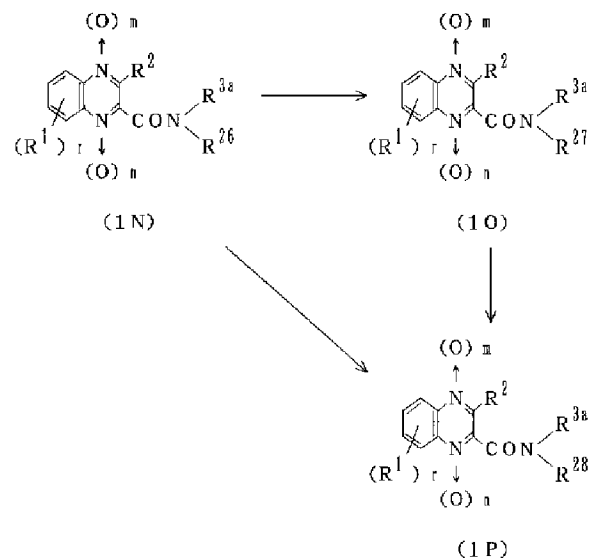
る溶媒としては、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル類、クロロホルム、塩化メチレン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類等を例示できる。ハロゲン化剤の使用割合としては、ハロゲン化剤としてトシルクロリド等のフェニル低級アルキルハライドと塩基性化合物を用いる場合には、化合物(1K)に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル〜2倍モル量使用するのがよい。その他のハロゲン化剤を用いる場合には、化合物(1K)に対して少なくとも等モル、通常大過剰量使用するのがよい。該反応は、通常室温〜150℃、好ましくは室温〜80℃にて、1〜80時間程度にて終了する。

【0693】化合物(1L)と化合物(13)との反応は、前記反応式-2における化合物(1a)と化合物(4a)の反応と同様の条件下に行なわれる。

【0694】

【化50】

反応式-13



【0695】〔式中 R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、 r 、 m 及び n は前記に同じ。 R^{26} はフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基を示す。 R^{27} はフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基を示す。 R^{28} は、フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基を示す。〕

化合物(1N)を化合物(1O)に導く反応及び化合物(1O)を化合物(1P)に導く反応は、前記反応式-

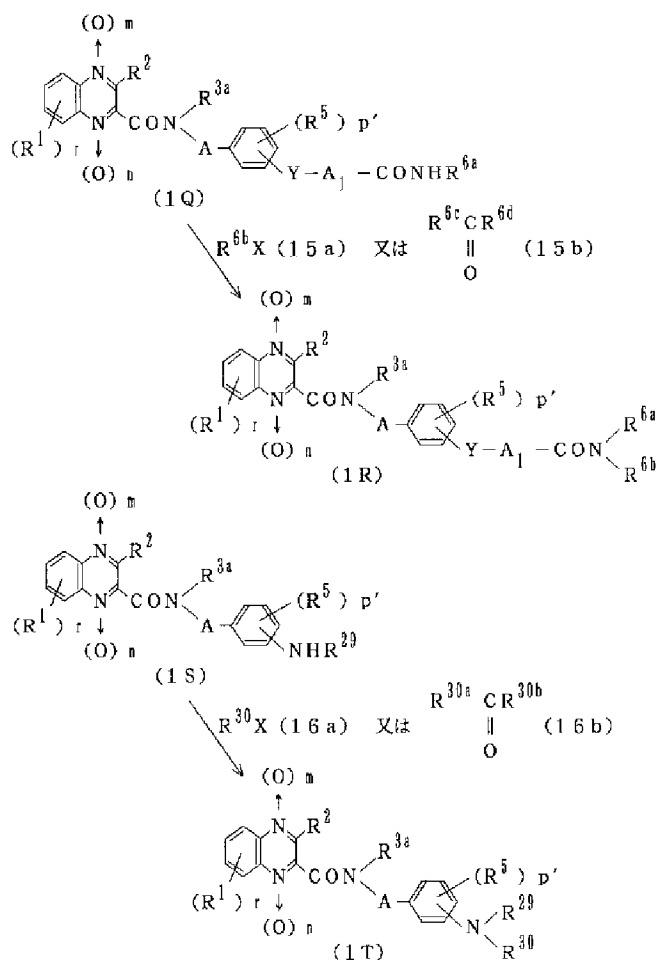
3における化合物(1c)を化合物(1d)に導く反応と同様の条件下に行なわれる。

【0696】化合物(1N)を化合物(1P)に導く反応は、酸化剤の使用量を化合物(1N)に対して少なくとも2倍モル、好ましくは2～4倍モルとする以外は、化合物(1N)を化合物(1O)に導く反応と同様の条件下に行なわれることができる。

【0697】

【化51】

反応式-14



【0698】〔式中 R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、 R^5 、 m 、 n 、 p' 、 X 、 A 、 A_1 、 r 及び Y は前記に同じ。 R^{6a} は水素原子、置換基として水酸基を有することのある低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニル低級アルキル基、フリル低級アルキル基又は低級アルコキシ置換低級アルキル基を示す。 R^{6b} は水素原子以外の前記 R^{6a} を示す。 R^{6c} 及び R^{6d} はそれぞれ水素原子又は低級アルキル基を示す。 R^{29} は水素原子又は低級アルキル基を示す。 R^{30} は低級アルキル基又は基 $-A_1-CONR^6R^7$ (A_1 、 R^6 及び R^7 は前記に同じ。)を示す。 R^{30a} 及び R^{30b} はそれぞれ水素原子又は低級アルキル基を示す。但し R^{30} が基 $-A_1-CONR^6R^7$ を示すとき、 R^{29} は水素原子を示すものとする。〕

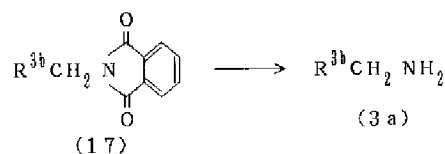
化合物(1Q)と化合物(15a)との反応及び化合物(1S)と化合物(16a)との反応は、それぞれ前記反応式-2における化合物(1a)と化合物(4a)との反応と同様の条件下に行なわれる。化合物(1Q)と化合物(15b)との反応及び化合物(1S)と化合物(16b)との反応は、それぞれ前記反応式-2における化合物(1a)と化合物(4b)の反応と同様の条件

下に行なわれる。出発原料である化合物(2)又は(3)は、例えば、下記反応式に示す方法にて製造することができる。

【0699】

【化52】

反応式-15



【0700】〔式中 R^{3b} は前記に同じ。但し、化合物(3a)の基 $R^{3b}CH_2-$ において R^{3b} の環状部分を除いた基 $R^{3b}CH_2-$ の炭素数の和は6を越えないものとする。〕

化合物(17)を化合物(3a)に導く反応は、適当な溶媒中で化合物(17)にヒドラジンを反応させるか又は加水分解することにより実施できる。ヒドラジンを反応させる際に使用される溶媒としては、水に加えて前記反応式-1における化合物(2)と化合物(3)との反応に用いられる溶媒と同様のものをいづれも使用でき

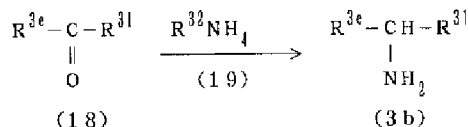
る。該反応は通常室温～120℃程度、好ましくは0～100℃程度で行まれ、一般に0.5～10時間程度にて終了する。ヒドラジンの使用量は化合物(17)に対して少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル～5倍モル量程度とするのがよい。

【0701】上記加水分解は、適当な溶媒中又は無溶媒で、酸又は塩基性化合物の存在下を実施することができる。用いられる溶媒としては例えば水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、酢酸、ギ酸等の脂肪酸類、これらの混合溶媒等を挙げることができる。酸としては例えば塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸やギ酸、酢酸、芳香族スルホン酸等の有機酸等を挙げることができ、また塩基性化合物としては例えば炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等の金属炭酸塩や水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物等を挙げることができる。該反応は通常室温～200℃程度、好ましくは室温～150℃程度にて好適に進行し、一般に10分～25時間程度で終了する。

【0702】

【化53】

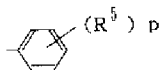
反応式-16



【0703】〔式中R³¹は水素原子、低級アルキル基又は低級アルケニル基を示す。R^{3e}は水素原子、低級アルキル基、基-(D)r'-R³³〔式中Dは低級アルキレン基を示す。r'は0又は1を示す。R³³は基

【0704】

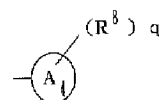
【化54】



【0705】(R⁵及びpは前記に同じ。)、低級アルカノイルオキシ置換低級アルキル基、低級アルコキシ低級アルキル基、低級アルカノイル基置換低級アルキル基、低級アルコキシカルボニルオキシ置換低級アルキル基、フェニル環上に置換基としてハロゲン原子を有することのあるベンゾイル置換低級アルキル基、基-E'-R⁵²R⁵³(R⁵²及びR⁵³は前記に同じ。E'は低級アルキレン基を示す。)、上記〔化26〕で示される基、シクロアルキル基、ナフチル基又は基

【0706】

【化55】



【0707】(式中R⁸及びqは前記に同じ。基

【0708】

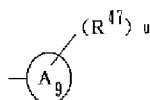
【化56】



【0709】は、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子なる群より選ばれたヘテロ原子を1～4個有する5～14員環の単環、二項環又は三項環の飽和又は不飽和複素環基を示す。)、フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基-O-A₄-CO-NR⁴⁰R⁴¹(A₄、R⁴⁰及びR⁴¹は前記に同じ。)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基、フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することのあるテトラゾリル基、水酸基、基-O-A₄-CO-NR⁴⁰R⁴¹(A₄、R⁴⁰及びR⁴¹は前記に同じ。)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル低級アルケニル基、フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ置換低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルフィニル置換低級アルキル基、フェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルスルホニル置換低級アルキル基、フェノキシ置換低級アルキル基、基-A₅-CR⁴²R⁴³R⁴⁴(式中A₅、R⁴²、R⁴³及びR⁴⁴は前記に同じ。)、2,3-ジヒドロ-1H-インデニル環上に置換基としてオキシ基、水酸基及び置換基として低級アルキル基を有するシリルオキシ基なる群より選ばれた基を有することのある2,3-ジヒドロ-1H-インデニル基置換低級アルキル基、上記〔化34〕で示される基、又は基

【0710】

【化57】



【0711】(式中 R^{47} 及び u は前記に同じ。

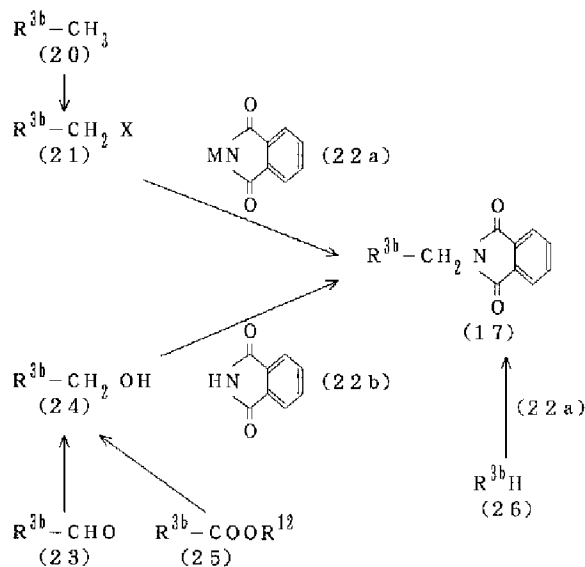
【0712】

【化58】



【0713】は、窒素原子、酸素原子及び硫黄原子なる群より選ばれたヘテロ原子を1〜4個有する5〜14員の単環、二項環又は三項環の飽和又は不飽和複素環基を示す。)を示す。但し、 R^{3e} がフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基、ハロゲン原子、置換基として低級アルカノイル基及びフェニル低級アルケニルカルボニル基なる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、低級アルコキシ基置換低級アルコキシ基、テトラゾール環上に置換基として低級アルキル基を有することの

反応式-17



【0716】〔式中 R^{3b} 、 R^{12} 及び X は前記に同じ。 M はカリウム、ナトリウム等のアルカリ金属原子を示す。化合物(17)の基 $-CH_2-R^{3b}$ において R^{3b} の環状部分を除いた基 $-CH_2-R^{3b}$ の炭素数の和は6を越えないものとする。〕

化合物(20)を化合物(21)に導く反応は、前記反応式-7における化合物(1p)のハロゲン化反応と同様の条件下に行なわれるが、反応系内に2-(4-ビフェニル)-5-フェニルオキサゾール、アゾビスイソブチロニトリル過安息香酸等のラジカル開始剤、適量の水(例えば3モル%)を添加するのが好ましい。

【0717】化合物(21)と化合物(22a)との反応は、前記反応式-2における化合物(1a)と化合物

あるテトラゾリル基、水酸基、基 $-O-A_4-CO-NR^{40}R^{41}$ (A_4 、 R^{40} 及び R^{41} は前記に同じ。)、低級アルケニルオキシ基、ニトロ基及び置換基としてハロゲン原子を有することのある低級アルキル基なる群より選ばれた基を有することのあるフェニル基又は上記〔化57〕で示される基を示すとき、 R^{31} は低級アルケニル基を示すものとする。また、化合物(3b)の基(R^{3e})(R^{31}) $CH-$ において、 R^{3e} の環状部分を除いた基(R^{3e})(R^{31}) $CH-$ の炭素数の和は6を越えないものとする。 R^{32} は低級アルカノイルオキシ基を示す。〕化合物(18)と化合物(19)との反応は、前記反応式-2における化合物(1a)と化合物(4b)との反応と同様の条件下に行なわれる。

【0714】出発原料として用いられる化合物(17)は例えば下記反応式-17に示す方法によって製造される。

【0715】

【化59】

(4a)との反応と同様の条件下に行なわれる。

【0718】化合物(23)を化合物(24)に導く反応は、前記反応式-8における化合物(1s)を化合物(1r)に導く反応と同様の条件下に行なわれる。

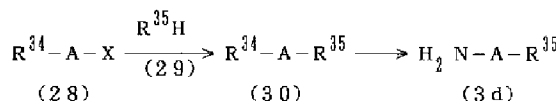
【0719】化合物(24)と化合物(22b)の反応は、適当な溶媒中、ジエチルアゾジカルボキシレート、ジブチルアゾジカルボキシレート等のジアルキルアゾジカルボキシレート類、1,1'-アゾジカルボニルジピペリジン等のジアルキルアゾジカルボキシアミド類等のアゾジカルボン酸誘導体及びトリメチルホスフィン等のトリアルキルホスフィン、トリフェニルホスフィン等のトリアリールホスフィン等のリン化合物の存在下に反応させることにより行なわれる。ここで使用される溶媒と

しては、前記反応式-2における化合物(1a)と化合物(4a)との反応で用いられる溶媒のうち低級アルコール類以外の溶媒をいずれも使用可能である。アゾジカルボン酸誘導体、リン化合物及び化合物(22b)の使用量は、それぞれ化合物(24)に対して通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～1.5倍モル量とするのがよい。該反応は通常0～100℃、好ましくは0～70℃付近にて、1～15時間程度にて終了する。

【0720】化合物(25)を化合物(24)に導く反応は、前記反応式-8における化合物(1s)を化合物(1r)に導く反応と同様の条件下に行なわれる。

【0721】化合物(26)と化合物(22a)との反応は、ホルムアルデヒド及び酸の存在下、適当な溶媒中で行なわれる。ここで使用される溶媒としては、例えばジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、酢酸、プロピオン酸等のアルカン酸、無水酢酸等の酸無水物、アセトン、ジメチルホルムアミド等の極性溶媒等又はこれらの混合溶媒等を例示できる。使用される酸としては、塩酸ガス、塩酸、臭化水素酸等の鉱酸等を例示できる。ホルムアルデヒドとしては、20～40重量%ホル

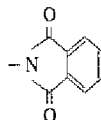
反応式-19



【0725】〔式中R³⁴は基

【0726】

【化62】



【0727】又は基-NR³⁶R³⁷ (R³⁶及びR³⁷はそれぞれフェニル低級アルキル基を示す。)を示す。R³⁵はフェニル環上に置換基として低級アルコキシ基を有することのあるフェニルチオ基又はフェノキシ基を示す。Aは前記に同じ。〕

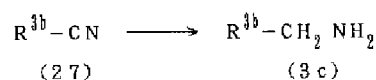
化合物(28)と化合物(29)との反応は、前記反応式-2における化合物(1a)と化合物(4a)の反応

ムアルデヒドを含む水溶液、三量体、ポリ重合体(パラホルムアルデヒド)等が通常使用される。化合物(22a)の使用量としては、化合物(26)に対して通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～2倍モル量とするのがよい。ホルムアルデヒドは、化合物(26)に対して、少なくとも等モル、通常大過剰量使用するのがよい。該反応は、通常0～200℃、好ましくは室温～150℃付近にて好適に進行し、0.5～24時間程度にて終了する。

【0722】

【化60】

反応式-18



【0723】〔式中R^{3b}は前記に同じ。〕

化合物(27)を化合物(3c)に導く反応は、前記反応式-8における化合物(1s)を化合物(1r)に導く反応と同様の条件下に行なわれる。

【0724】

【化61】

と同様の条件下に行なわれる。

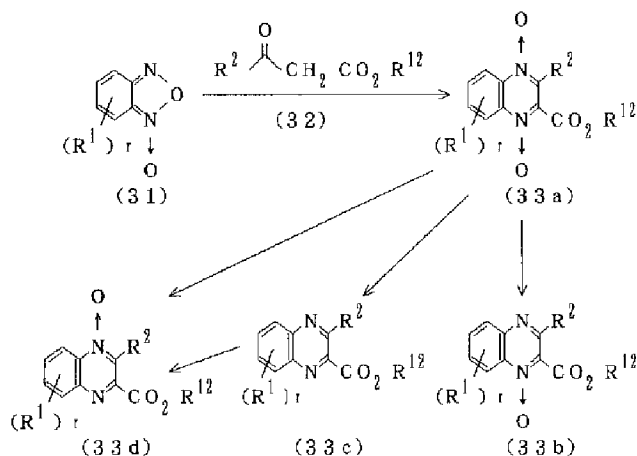
【0728】化合物(30)を化合物(3d)に導く反応は、化合物(30)でR³⁴が上記【化62】で示される基を示すときは、前記反応式-15における化合物(17)を化合物(3a)に導く反応と同様の条件下に行なわれる。

【0729】化合物(30)でR³⁴が基-NR³⁶R³⁷を示すときは、前記反応式-6における化合物(1o)を化合物(1m)に導く反応で、R¹⁴がフェニル低級アルコキシ基である化合物の還元反応と同様の条件下に行なわれる。

【0730】

【化63】

反応式-20



【0731】〔式中 R^1 、 R^2 、 R^{12} 及び r は前記に同じ。〕

化合物(31)と化合物(32)との反応は、塩基性化合物の存在下に行なわれる。ここで使用される塩基性化合物としては、前記反応式-2における化合物(1a)と化合物(4a)との反応で用いられた塩基性化合物をいずれも使用することができる。化合物(32)は、化合物(31)に対して通常少なくとも等モル、好ましくは等モル〜5倍モル量使用するのがよい。該反応は、通常0〜100℃、好ましくは0〜70℃付近にて、1時間〜5日間程度にて終了する。

【0732】化合物(33a)を化合物(33b)に導く反応は、適当な溶媒中、三臭化リン、三塩化リン等のハロゲン化リン化合物の存在下に行なわれる。使用される溶媒としては、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル類、クロロホルム、塩化メチレン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類等を例示できる。ハロゲン化リン化合物は、化合物(33a)に対して等モル〜2倍モル量使用するのがよい。該反応は、通常0〜100℃、好ましくは0〜70℃付近にて、0.5〜5時間程度にて終了する。

【0733】化合物(33a)を化合物(33c)に導く反応は、適当な溶媒中、酸の存在下、化合物(33a)をハイドロサルファイトナトリウムと反応させることにより行なわれる。ここで使用される溶媒としては、例えば、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、3-メトキシ-1-ブタノール、エチルセロソルブ、メチルセロソルブ等のアルコール類、水等を挙げることができる。また使用される酸としては、塩酸、等の鉱酸を挙げることができる。ハイドロサルファイトナトリウムは、化合物(33a)に対して通常少なくとも等モル、好ましくは等モル〜5倍モル量使用するのがよい。該反応は通常0〜100℃、好ましくは0〜70℃付近にて、1〜10時間程度で終了する。

【0734】化合物(33c)を化合物(33d)に導

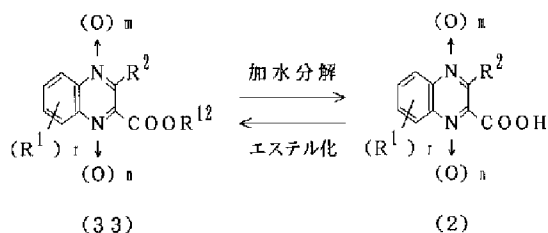
く反応は、前記反応式-3における化合物(1c)を化合物(1d)に導く反応と同様の条件下に行なわれる。

【0735】化合物(33a)を化合物(33d)に導く反応は、リン化合物として、ハロゲン化リン化合物の代わりにトリメチルフォスファイト等のトリアルキルフォスファイト類を用いる以外は、前記化合物(33a)を化合物(33b)に導く反応と同様の条件下に行なわれるが、ここで溶媒として1-プロパノール等のアルコール類を使用してもよく、反応温度としては通常0〜150℃、好ましくは0〜100℃付近にて行なうのがよい。

【0736】

【化64】

反応式-21



【0737】〔式中 R^1 、 R^2 、 R^{12} 、 r 、 m 及び n は前記に同じ。〕

化合物(33)の加水分解反応は、前記反応式-5における化合物(1j)の加水分解反応と同様の条件下に行なわれる。

【0738】化合物(2)のエステル化反応は、例えば塩酸、硫酸等の鉱酸、チオニルクロリド、オキシ塩化リン、五塩化リン、三塩化リン等のハロゲン化剤の存在下、原料化合物をメタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類と、通常0〜150℃、好ましくは50〜100℃にて、5分〜10時間程度反応させることにより行なわれる。

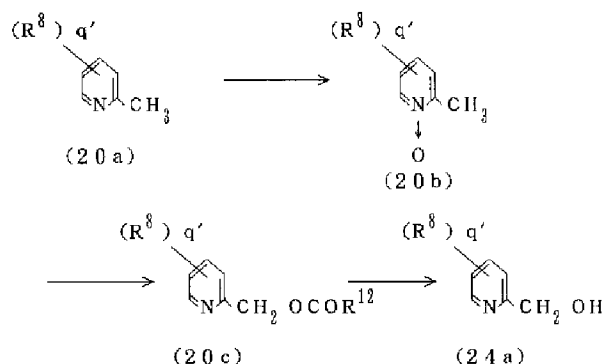
【0739】中間体の化合物(24a)は、下記反応式

—22に示す方法によっても製造できる。

【化65】

【0740】

反応式—22



【0741】〔式中R⁸、q'及びR¹²は前記に同じ。〕

化合物(20a)を化合物(20b)に導く反応は、適当な溶媒中、酸化剤の存在下に行なわれる。ここで使用される溶媒及び酸化剤は、前記反応式—3における化合物(1c)を化合物(1d)に導く反応で用いた溶媒及び酸化剤をいずれも使用可能である。酸化剤は化合物(20a)に対して通常大過剰量使用するのがよい。該反応は、通常室温～150℃、好ましくは室温～120℃付近にて、1～20時間程度にて終了する。

【0742】化合物(20b)を化合物(20c)に導く反応は、一般式 R¹²COOCH₂ (R¹²は前記に同じ。)で表わされる化合物中、通常室温～200℃、好ましくは室温～150℃付近にて1～10時間加熱することにより行なわれる。

【0743】化合物(20c)を化合物(24a)の導く反応は、前記反応式—5における化合物(1j)の加水分解反応と同様の条件下に行なわれる。

【0744】R⁵又はR⁸がアミノ基を示す一般式(1)の化合物は、対応するR⁵又はR⁸がニトロ基を示す化合物を還元することにより製造される。

【0745】該還元反応は、例えば適当な溶媒中接触還元触媒を用いて還元するか又は適当な不活性溶媒中、金属もしくは金属塩と酸又は金属もしくは金属塩とアルカリ金属水酸化物、硫化物、アンモニウム塩等との混合物等を還元剤として用いて還元することにより行なわれる。

【0746】の還元触媒を用いる場合、使用される溶媒としては、例えば水、酢酸、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類、ヘキサン、シ

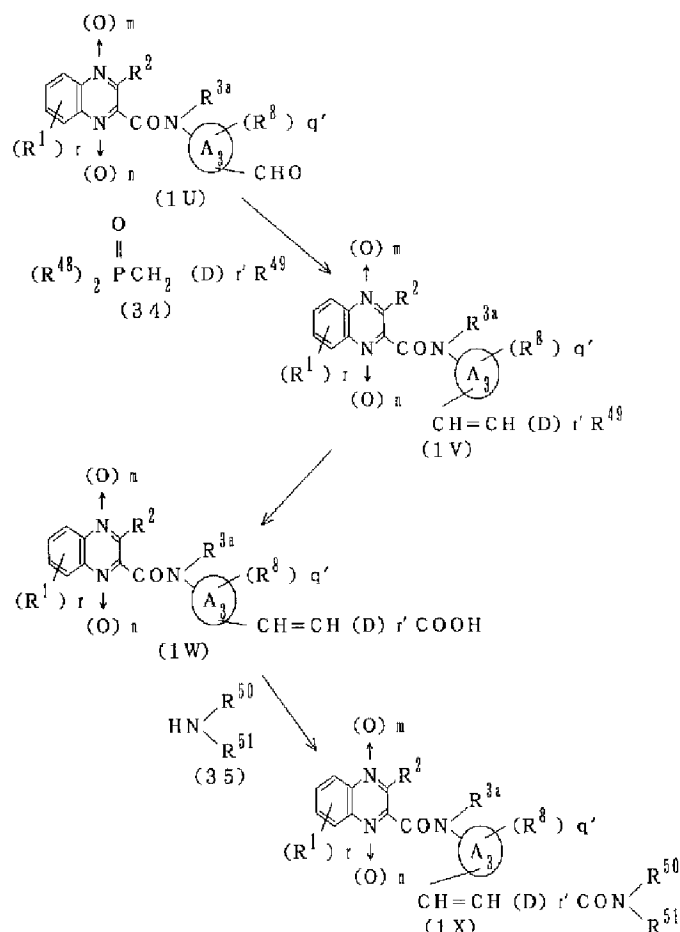
クロヘキサン等の炭化水素類、ジオキサン、テトラヒドロフラン、ジエチルエーテル、ジエチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、N、N-ジメチルホルムアミド等の非プロトン性極性溶媒等又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。使用される接触還元触媒としては、例えばパラジウム、パラジウム黒、パラジウム炭素、白金、酸化白金、亜クロム酸銅、ラネーニッケル等が挙げられる。触媒は、出発原料に対して一般に0.02～1倍量程度用いるのがよい。反応温度は、通常20～150℃付近、好ましくは0～100℃付近、水素圧は通常1～10気圧とするのがよく、該反応は一般に0.5～10時間程度で終了する。また該反応には塩酸等の酸を添加してもよい。

【0747】またの方法を用いる場合、鉄、亜鉛、錫もしくは塩化第一錫と塩酸、硫酸等の鉱酸、又は鉄、硫酸第一鉄、亜鉛もしくは錫と水酸化ナトリウム等のアルカリ金属水酸化物、硫化アンモニウム等の硫化物、アンモニア水、塩化アンモニウム等のアンモニウム塩との混合物が還元剤として用いられる。使用される不活性溶媒としては、例えば水、酢酸、メタノール、エタノール、ジオキサン等を例示できる。上記還元反応の条件としては、用いられる還元剤によって適宜選択すればよく、例えば塩化第一錫と塩酸とを還元剤として用いる場合、有利には0℃～室温付近、0.5～10時間程度反応を行なうのがよい。還元剤は、原料化合物に対して少なくとも等モル量、通常は等モル～5倍モル量用いられる。

【0748】

【化66】

反応式-23



【0749】〔式中 R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、 R^8 、 R^{3g} 、 m 、 n 、 q' 、 D 、 r 、 r' 及び上記〔化29〕で示される基は前記に同じ。 R^{4g} は低級アルコキシ基を示す。 R^{4g} は低級アルコシカルボニルを示す。 R^{50} 及び R^{51} は同一又は異なって水素原子又は低級アルキル基を示す。〕

化合物(1U)と化合物(34)との反応は、塩基性化合物の存在下、適当な溶媒中で行なわれる。用いられる塩基性化合物としては、金属ナトリウム、金属カリウム、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート、カリウムセブトキシド等の金属アルコラート類、メチルリチウム、 n -ブチルリチウム、フェニルリチウム、リチウムジイソプロピルアミド等のアルキル及びアリールリチウム又はリチウムアミド類、ピリジン、ピペリジン、キノリン、トリエチルアミン、 N 、 N -ジメチルアニリン等の有機塩基等を例示できる。溶媒としては、反応に影響を与えないものであればいずれも使用できるが、例えばジエチルエー

テル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、 n -ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサン等の脂肪族炭化水素類、ピリジン、 N 、 N -ジメチルアニリン等のアミン類、 N 、 N -ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチルリン酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒、メタノール、エタノール、イソプロパノール等のアルコール類等が挙げられる。反応温度は、通常 $-80 \sim 150^\circ\text{C}$ 、好ましくは $-80 \sim 120^\circ\text{C}$ 付近とするのがよく、一般に0.5~15時間程度で反応は終了する。

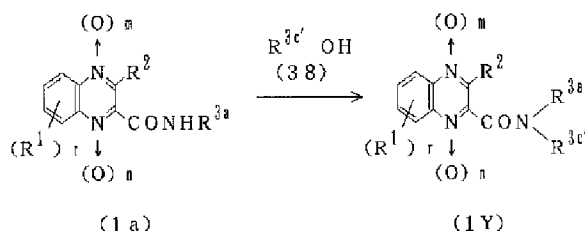
【0750】化合物(1V)を化合物(1W)に導く反応は、前記反応式-5における化合物(1j)の加水分解反応と同様の反応条件下に行ない得る。

【0751】化合物(1W)と化合物(35)との反応は、前記反応式-1における化合物(2)と化合物(3)との反応と同様の反応条件下に行ない得る。

【0752】

【化67】

反応式-24



【0753】〔式中 R^1 、 R^2 、 m 、 n 、 r 及び R^{3a} は前記に同じ。 $R^{3c'}$ はフェニル低級アルコキシカルボニル基、低級アルカノイル基、低級アルコキシカルボニル基、フェノキシカルボニル基又は基 $-CO-ANR^{52}R^{53}$ (R^{52} 、 R^{53} 及び A は前記に同じ)を示す。〕

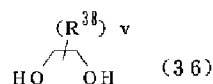
化合物(1a)と化合物(38)との反応は、前記反応式-1における化合物(2)と化合物(3)との反応と同様の反応条件下に行ない得る。ここでカルボン酸無水物とアミンとの反応は、前記化合物(2)と化合物(3)との反応における活性エステル法を用いる反応と同様の溶媒及び塩基性化合物の存在下、通常0～150℃、好ましくは10～100℃で行なわれ、一般に5～30時間で完結する。カルボン酸無水物の使用量としては、化合物(1a)に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル～2倍モル量とするのがよい。

【0754】 R^8 が低級アルカノイル基を示す一般式(1)の化合物は、対応する R^8 がシアノ基を示す化合物に、一般式 $R^{17}MgX$ (11) (R^{17} 及び X は前記に同じ。)で表わされる化合物と反応させた後加水分解することにより製造される。該化合物(1)と化合物(11)との反応は、前記反応式-8における化合物(1s)と化合物(11)との反応と同様の条件下に行なわれる。引続き行なわれる加水分解反応は、前記反応式-5における化合物(1j)の加水分解反応と同様の条件下に行なわれる。なお該反応は、酸の存在下で実施するのが好ましい。

【0755】 R^5 が置換基として低級アルキル基を有することのある1, 3-ジオキサニル基又は R^8 が置換基として低級アルキル基を有することのある1, 3-ジオキサニル置換低級アルキル基を示す一般式(1)の化合物は、対応する R^5 が低級アルカノイル基又は R^8 が低級アルカノイル基置換低級アルキル基を示す化合物に、一般式

【0756】

【化68】



【0757】(式中 R^{3b} は低級アルキル基を示す。 v は0又は1～3の整数を示す。)で表わされる化合物を反応させることにより得ることができる。該反応は適当な

溶媒中、酸の存在下に行なわれる。ここで使用される溶媒としては、塩化メチレン、ジクロロエタン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素類に加えて、前記反応式-2における化合物(1a)と化合物(4a)で用いた溶媒をいずれも使用することができる。使用される酸としては、例えば塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸、p-トルエンスルホン酸等の有機酸等を例示できる。化合物(36)は、出発原料に対して通常少なくとも等モル、好ましくは等モル～10倍モル量使用するのがよい。該反応は、通常室温～150℃、好ましくは室温～100℃付近にて、1～24時間程度で終了する。

【0758】 R^5 が低級アルカノイル基又は R^8 が低級アルカノイル基置換低級アルキル基を示す一般式(1)の化合物は、対応する R^5 が置換基として低級アルキル基を有することのある1, 3-ジオキサニル基又は R^8 が置換基として低級アルキル基を有することのある1, 3-ジオキサニル置換低級アルキル基である化合物を加水分解することにより得ることができる。該加水分解反応は、適当な溶媒中、酸の存在下に行なわれることができる。ここで使用される溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。酸としては、例えば、塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸、p-トルエンスルホン酸等の有機酸等を挙げることができる。該反応は、通常0～70℃、好ましくは0℃～室温付近にて、1～10時間程度にて終了する。

【0759】 R^8 が置換基として低級アルキル基又は低級アルコキシ低級アルキル基を有するテトラゾリル基を示す一般式(1)の化合物は、対応する R^8 がテトラゾリル基である化合物に一般式 $R^{39}X$ (37) (式中 R^{39} は低級アルキル基又は低級アルコキシ低級アルキル基を示す。 X は前記に同じ。)で表わされる化合物を前記反応式-2における化合物(10)と化合物(4a)の反応と同様の条件下に反応することにより製造される。

【0760】 R^8 が無置換のテトラゾリル基を示す一般式(1)の化合物は、対応する R^8 が置換基として低級アルコキシ低級アルキル基を有するテトラゾリル基を示す化合物を、前記反応式-6において R^{14} が低級アルコ

キシ置換低級アルコキシ基である化合物(10)の加水分解反応と同様の条件下に加水分解することにより製造される。

【0761】 R^2 がモルホリノ置換低級アルキル基又はイミダゾリル置換低級アルキル基を示す一般式(1)の化合物は、対応する R^2 がハロゲン原子を有する低級アルキル基を示す化合物とモルホリン又はイミダゾールとを、前記反応式-2における化合物(1a)と化合物(4a)の反応と同様の条件下に、反応させることにより製造される。

【0762】 R^2 がハロゲン置換メチル基を示す一般式(1)の化合物は、対応する R^2 がメチル基である化合物を前記反応式-17における化合物(20)を化合物(21)に導く反応と同様の条件下に反応させることにより製造される。また該ハロゲン置換メチル基におけるハロゲン原子が弗素原子の場合には、対応する弗素原子以外のハロゲン置換メチル基を示す一般式(1)の化合物に弗化銀を反応させることによって製造される。

【0763】一般式(1)で表わされる本発明化合物のうち、塩基性基を有する化合物は、医薬的に許容される酸を作用させることにより容易に酸付加塩とすることができる。該酸としては、例えば塩酸、硫酸、リン酸、臭化水素酸等の無機酸、シュウ酸、酢酸、コハク酸、マロン酸、メタンスルホン酸、マレイン酸、フマル酸、リンゴ酸、酒石酸、クエン酸、安息香酸等の有機酸を挙げることができる。

【0764】また、一般式(1)で表わされる本発明化合物のうち、酸性基を有する化合物は、医薬的に許容される塩基性化合物を作用させることにより容易に塩とすることができる。該塩基性化合物としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素カリウム等を挙げることができる。

【0765】このようにして得られる各々の行程の目的化合物は、通常、分離手段により容易に単離精製することができる。該分離手段としては、例えば溶媒抽出法、希釈法、再結晶法、カラムクロマトグラフィー、プレパラティブ薄層クロマトグラフィー等を例示できる。

【0766】尚、本発明化合物には、光学異性体及び立体異性体も包含される。

【0767】一般式(1)の化合物は通常、一般的な医薬製剤の形態で用いられる。製剤は通常使用される充填剤、増量剤、結合剤、付湿剤、崩壊剤、表面活性剤、滑沢剤等の希釈剤あるいは賦形剤を用いて調製される。この医薬製剤としては各種の形態が治療目的に応じて選択でき、この代表的なものとして錠剤、丸剤、散剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤、カプセル剤、坐剤、注射剤(液剤、懸濁剤等)等が挙げられる。錠剤の形態に成形するに際しては、担体としてこの分野で従来公知のものを広く使用でき、例えば乳糖、白糖、塩化ナトリウム、

ブドウ糖、尿素、デンプン、炭酸カルシウム、カオリン、結晶セルロース、ケイ酸等の賦形剤、水、エタノール、プロパノール、単シロップ、ブドウ糖液、デンプン液、ゼラチン溶液、カルボキシメチルセルロース、セラック、メチルセルロース、リン酸カリウム、ポリビニルピロリドン等の結合剤、乾燥デンプン、アルギン酸ナトリウム、カンテン末、ラミナラン末、炭酸水素ナトリウム、炭酸カルシウム、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類、ラウリル硫酸ナトリウム、ステアリン酸モノグリセリド、デンプン、乳糖等の崩壊剤、白糖、ステアリン、カカオバター、水素添加油等の崩壊抑制剤、第4級アンモニウム塩基、ラウリル硫酸ナトリウム等の吸収促進剤、グリセリン、デンプン等の保湿剤、デンプン、乳糖、カオリン、ベントナイト、コロイド状ケイ酸等の吸着剤、精製タルク、ステアリン酸塩、ホウ酸末、ポリエチレングリコール等の滑沢剤等が例示できる。更に錠剤は必要に応じ通常の剥皮を施した錠剤、例えば糖衣錠、ゼラチン被包錠、腸溶被錠、フィルムコーティング錠あるいは二重錠、多層錠とすることができる。丸剤の形態に成形するに際しては、担体としてこの分野で従来公知のものを広く使用でき、例えばブドウ糖、乳糖、デンプン、カカオ脂、硬化植物油、カオリン、タルク等の賦形剤、アラビアゴム末、トラガント末、ゼラチン、エタノール等の結合剤、ラミナランカンテン等の崩壊剤等が例示できる。坐剤の形態に成形するに際しては、担体として従来公知のものを広く使用でき、例えばポリエチレングリコール、カカオ脂、高級アルコール、高級アルコールのエステル類、ゼラチン、半合成グリセライド等を挙げることができる。注射剤として調製される場合には、液剤及び懸濁剤は殺菌され、且つ血液と等張であるのが好ましく、これら液剤、乳剤及び懸濁剤の形態に成形するに際しては、希釈剤としてこの分野において慣用されているものを全て使用でき、例えば水、エチルアルコール、プロピレングリコール、エトキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類等を挙げることができる。尚、この場合等張性の溶液を調製するに充分な量の食塩、ブドウ糖あるいはグリセリンを医薬製剤中に含有せしめてもよく、また通常の溶解補助剤、緩衝剤、無痛化剤等を添加してもよい。更に必要に応じて着色剤、保存剤、香料、風味剤、甘味剤等や他の医薬品を医薬製剤中に含有せしめてもよい。

【0768】本発明の一般式(1)の化合物又はその塩を医薬製剤中に含有させるべき量は、特に限定されず広範囲内から適宜選択されるが、通常医薬製剤中に1~70重量%とするのがよい。

【0769】上記医薬製剤の投与方法は特に制限はなく、各種製剤形態、患者の年齢、性別その他の条件、疾患の程度等に応じた方法で投与される。例えば錠剤、丸

剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤及びカプセル剤の場合には経口投与される。また注射剤の場合には単独で或いはブドウ糖、アミノ酸等の通常の補液と混合して静脈内投与され、更に必要に応じて単独で筋肉内、皮内、皮下もしくは腹腔内投与される。坐剤は直腸内投与される。

【0770】上記の医薬製剤の投与量は用法、患者の年

2-〔2-ベンゾフラニルメチルアミノカルボニル〕-3-メチル キノキサリン-4-オキシド	5mg
デンプン	132mg
マグネシウムステアレート	18mg
乳糖	45mg
計	200mg

常法により1錠中、上記組成物の錠剤を製造した。

【0772】製剤例2

2-〔3-〔4-メトキシフェニル〕プロピルアミノカルボニル〕- 3-メチルキノキサリン-4-オキシド	150mg
アビセル(商標名、旭化成(株)製)	40g
コーンスターチ	30g
ステアリン酸マグネシウム	2g
ヒドロキシプロピルメチルセルロース	10g
ポリエチレングリコール-6000	3g
ヒマシ油	40g
メタノール	40g

本発明化合物、アビセル、コーンスターチ及びステアリン酸マグネシウムを混合研摩後、糖衣R10mmのキネで打錠する。得られた錠剤をヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリエチレングリコール-6000、ヒマシ油及びメタノールからなるフィルムコーティング剤で被覆を行ないフィルムコーティング錠を製造する。

【0773】参考例1

2-エトキシカルボニル-3-メチルベンゾフラン5.0gの無水ジエチルエーテル溶液10mlを水素化アルミニウムリチウム0.93gのジエチルエーテル30ml懸濁溶液に氷冷下、滴下した。室温で30分攪拌後、冷却し、飽和硫酸ナトリウム水溶液で分解し、セライト汙過し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を留去し白色粉末として、3.7gの2-ヒドロキシメチル-3-メチルベンゾフランを得た。

【0774】 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm;

1.82 (1H, t, $J=6\text{Hz}$)、2.27 (3H, s)、4.76 (2H, d, $J=6\text{Hz}$)、7.20-7.55 (4H, m)。

【0775】参考例2

2-ヒドロキシメチル-3-メチルベンゾフラン3.7g、トリフェニルホスフィン6.6g及びフタルイミド3.7gをテトラヒドロフラン40mlに懸濁し、氷冷下、アゾジカルボン酸ジエチル4.4gのテトラヒドロフラン10ml溶液を滴下し、室温で一夜攪拌した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒; 塩化メチレン)にて精製後、ジエチルエーテルを加え結晶化し、汙取、乾燥し、白色粉末として4.6

g、性別その他の条件、疾患の程度等により適宜選択されるが、通常有効成分である一般式(1)の化合物又はその塩の量は1日当たり体重1kg当たり約0.2~200mg程度とするのがよい。

【0771】製剤例1

gの3-メチル-2-フタルイミドメチルベンゾフランを得た。

【0776】 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm;

2.40 (3H, s)、4.97 (2H, s)、7.10-7.30 (2H, m)、7.40 (1H, d, $J=7\text{Hz}$)、7.48 (1H, d, $J=7\text{Hz}$)、7.65-7.75 (2H, m)、7.80-7.90 (2H, m)。

【0777】参考例3

3-メチル-2-フタルイミドメチルベンゾフラン4.6gをメタノール80mlに加え、ヒドラジン水和物1.2gを加え3時間遠流した。溶媒を留去し、残渣に希水酸化ナトリウム水溶液を加えクロロホルム抽出した。クロロホルム層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を留去し、無色透明液体として3.0gの2-アミノメチル-3-メチルベンゾフランを得た。

【0778】 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm;

1.55 (2H, brs)、2.21 (3H, s)、3.93 (2H, s)、7.15-7.30 (2H, m)、7.35-7.50 (2H, m)。

【0779】参考例4

2-メチルベンゾチオフェン4.0g、N-ブロムコハク酸イミド4.8g及びアゾビスイソブチロニトリル0.3gを四塩化炭素50mlに加え、5時間還流した。冷却後不溶物を汙去後濃縮した。茶色粉末として2-ブロモメチルベンゾチオフェン6.7gを得た。

【0780】 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm;

4.79 (2H, s)、7.30-7.45 (2H, m)、7.36 (1H, s)、7.70-7.85 (2H, m)。

【0781】参考例5

2-ブロモメチルベンゾチオフェン6.7gをジメチルホルムアミド40mlに溶解し、フタルイミドカリウム5.0gを加え60℃で2時間攪拌した。ジメチルホルムアミドを留去し、残渣をクロロホルム抽出し、水、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を留去し、残渣にジエチルエーテルを加え結晶を回収、乾燥し、淡茶色粉末として2-フタルイミドメチルベンゾチオフェン4.5gを得た。

【0782】¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm;

5.10 (2H, s)、7.20-7.40 (3H, m)、7.70-7.80 (4H, m)、7.80-7.95 (2H, m)。

【0783】参考例6

3-ホルミルベンゾフラン4.3gをメタノール50mlに溶解し、氷冷下、水素化ホウ素ナトリウム1.1gを徐々に加えた。同温度で1時間攪拌後、メタノールを留去し、残渣をクロロホルム抽出し、水洗後、無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を留去し、淡黄色液体として4.1gの3-ヒドロキシメチルベンゾフランを得た。

【0784】¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm;

1.62 (1H, t, J=5Hz)、4.85 (2H, d, J=5Hz)、7.20-7.45 (2H, m)、7.53 (1H, d, J=8Hz)、7.62 (1H, s)、7.68 (1H, d, J=8Hz)。

【0785】参考例7

エチル2-ベンゾフランアクリレート3.46gの無水トルエン溶液を-50℃に冷却し、水素化ジイソブチルアルミニウム(1Mトルエン溶液, 37ml)を滴下した。-20℃で1時間攪拌した後、メタノール30mlを加え、室温で一夜攪拌した。沈殿物をセライトろ過し濃縮した。残渣を酢酸エチルに溶解しフロリジルろ過し濃縮して、無色液体の2-(3-ヒドロキシ-1-プロペニル)ベンゾフラン2.6gを得た。

【0786】¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm;

4.39 (2H, brs)、6.60 (3H, m)、7.17-7.32 (2H, m)、7.43 (1H, d, J=7Hz)、7.52 (1H, d, J=7Hz)。

【0787】参考例8

ベンゾチオフェン13.4gと37%ホルムアルデヒドの水溶液15mlの混合物に氷冷下、塩化水素ガスを導入した(約20~30分)。更に室温で2時間攪拌した。反応液を氷水にかけ、ジエチルエーテルで抽出した。得られた有機層を、飽和炭酸水素ナトリウムで洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、得

られた残渣とフタルイミドカリウム18.5gとをジメチルホルムアミド100mlに溶かし、60℃で1.5時間加熱した。冷後、氷水にかけ析出物を回収した。得られた結晶をジイソプロピルエーテルで洗浄して、淡褐色結晶の3-フタルイミドメチルベンゾチオフェン13.4gを得た。

【0788】¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm;

5.08 (2H, s)、7.3-7.5 (2H, m)、7.61 (1H, s)、7.6-7.9 (5H, m)、8.15 (1H, d, J=8Hz)。

【0789】参考例9

2-アセチルベンゾフラン3.2gをメタノール60mlに溶解し、酢酸アンモニウム15g、ナトリウムシアノボロヒドリド1.26gを加えた。室温で一夜攪拌後、希塩酸水溶液を加えて酸性とし酢酸エチルで洗浄した。水層を水酸化ナトリウム水溶液でアルカリ性としクロロホルム抽出した。クロロホルム層を水洗後、無水硫酸ナトリウム上で乾燥したクロロホルムを留去し、無色液体として1.8gの2-(1-アミノエチル)ベンゾフランを得た。

【0790】¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm;

1.52 (3H, d, J=6Hz)、1.83 (2H, brs)、4.20 (1H, q, J=6Hz)、6.50 (1H, s)、7.15-7.30 (2H, m)、7.43 (1H, d, J=8Hz)、7.51 (1H, d, J=8Hz)。

【0791】参考例10

5-エチル-2-メチルピリジン25gを酢酸200mlに溶かし、30%過酸化水素水溶液25mlを加え、100℃に加熱した。4時間後更に30%過酸化水素水溶液25mlを加えて、同温度で14時間加熱攪拌した。冷後、数回水を加えて濃縮し、最終的に得られた残渣に飽和炭酸カリウム水溶液を加えて中和し、クロロホルムより抽出した。無水炭酸カリウムで乾燥後、溶媒を留去した。得られた残渣を無水酢酸200mlに溶かし、120℃で4時間加熱した。溶媒留去後、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルより抽出した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後、溶媒を留去した。残渣をメタノール200mlに溶かし、炭酸カリウム57gを加え、室温下で12時間攪拌した。溶媒留去後、水を加え、クロロホルムより抽出し、無水炭酸カリウムで乾燥した。溶媒留去後、得られた残渣を、シリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:酢酸エチル:n-ヘキサン=1:4)に付し、淡褐色液体の5-エチル-2-ヒドロキシメチルピリジン20.4gを得た。

【0792】¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm;

1.26 (3H, t, J=8Hz)、2.66 (2H, q, J=8Hz)、3.67 (1H, br)、4.73 (2H, s)、7.18 (1H, d, J=8Hz)、7.52 (1H, d, J=8Hz)、8.41 (1H,

s)。

【0793】参考例11

4-(2-メチル-1,3-ジオキサラン-2-イル)ベンゾニトリル1.9gをジエチルエーテル20mlに溶かし、0℃にて水素化アルミニウムリチウム400mgを加えた。室温にて14時間反応を行なった後、反応液に水1ml及び8モル水酸化ナトリウム水溶液3mlを加えた。更に硫酸マグネシウムを加え、不溶物を濾去した。溶媒を濃縮して無色油状の〔4-(2-メチル-1,3-ジオキサラン-2-イル)ベンジル〕アミン2.1gを得た。

【0794】 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 7.45 (2H, d, $J=8\text{Hz}$)、7.29 (2H, d, $J=8\text{Hz}$)、4.04 (2H, m)、3.87 (2H, s)、3.77 (2H, m)、1.77 (2H, br)、1.65 (3H, s)。

【0795】参考例12

N-ブロムエチルフタルイミド13g及びp-メトキシチオフェノール7.9gをジメチルホルムアミド70mlに溶解し、炭酸カリウム10gを加え70℃で一夜撹拌した。ジメチルホルムアミドを留去し、残渣をジエチルエーテル抽出し、水洗後、無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。ジエチルエーテルを留去し、n-ヘキサンで結晶化後濾取、乾燥し、白色粉末として13.9gのN-〔2-(4-メトキシフェニルチオ)エチル〕フタルイミドを得た。

【0796】 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 3.14 (2H, t, $J=7\text{Hz}$)、3.75 (3H, s)、3.89 (2H, t, $J=7\text{Hz}$)、6.80 (2H, d, $J=8\text{Hz}$)、7.42 (2H, d, $J=8\text{Hz}$)、7.65-7.75 (2H, m)、7.75-7.90 (2H, m)。

【0797】参考例13

N-(2-クロロエチル)ジベンジルアミン・塩酸塩25g及びフェノール8.0gをジメチルホルムアミド100mlに溶解し、炭酸カリウム30gを加え70℃で6時間撹拌した。ジメチルホルムアミドを留去し、残渣をジエチルエーテル抽出し、水洗後無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。ジエチルエーテルを留去し、無色油状物として25.5gのN-(2-フェノキシエチル)ジベンジルアミンを得た。

【0798】 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 2.90 (2H, t, $J=6\text{Hz}$)、3.72 (4H, s)、4.03 (2H, t, $J=6\text{Hz}$)、6.80 (2H, d, $J=8\text{Hz}$)、6.85-7.00 (1H, m)、7.15-7.45 (12H, m)。

【0799】参考例14

N-(2-フェノキシエチル)ジベンジルアミン25.5gをエタノール500mlに溶解し、10%パラジウム炭素3.0gを加え、50℃、1気圧で水素添加し

た。触媒を濾去し、エタノールを留去し、無色油状物として11.0gの2-フェノキシエチルアミンを得た。

【0800】 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 1.47 (2H, brs)、3.08 (2H, t, $J=5\text{Hz}$)、4.01 (2H, t, $J=5\text{Hz}$)、6.85-7.00 (3H, m)、7.25-7.35 (2H, m)。

【0801】参考例15

ベンゾフロキサン216g及びアセト酢酸エチル207gをトリエチルアミン1.5リットルに加え、4日間室温で撹拌した。析出品を濾取、水洗、乾燥後、酢酸エチルより再結晶し、115gの2-エトキシカルボニル-3-メチルキノキサリン-1,4-ジオキドを淡黄色針状品として得た。m. p. 137-138℃。

【0802】参考例16

2-エトキシカルボニル-3-メチルキノキサリン-1,4-ジオキド77gをエタノール3.5リットル及び濃塩酸200mlに溶解し、室温撹拌下ハイドロサルファイトナトリウム200gの水溶液(1リットル)を滴下した。同温度で4時間撹拌後、反応液を炭酸水素ナトリウムで中和し、エタノールを留去した。残渣に水を加え、析出品を濾取、水洗、乾燥後、n-ペンタンより再結晶し、無色針状品の2-エトキシカルボニル-3-メチルキノキサリン67gを得た。m. p. 74-75℃。

【0803】参考例17

2-エトキシカルボニル-3-メチルキノキサリン64gを塩化メチレン700mlに溶解し、氷冷下メタクロル過安息香酸70gを徐々に加えた。室温で一夜撹拌後反応液を希チオ硫酸ナトリウム水溶液、飽和重曹水、水の順に洗浄し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を留去し、残渣にn-ヘキサンを加え、結晶を濾取、乾燥後n-ヘキサンジエチルエーテルより再結晶し、無色針状品の2-エトキシカルボニル-3-メチルキノキサリン-4-オキド45gを得た。m. p. 91-93℃。

【0804】参考例18

2-エトキシカルボニル-3-メチルキノキサリン-1,4-ジオキド105gをクロロホルム500mlに溶解し、氷冷下、三臭化リン44mlを徐々に滴下した。室温で1時間撹拌後クロロホルムを留去し、残渣を氷水にあげ、炭酸カリウムで中和した。クロロホルム抽出し、水洗後、無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒; n-ヘキサン: 酢酸エチル=2:1)で精製後、酢酸エチル-n-ヘキサンより再結晶し、無色プリズム状品の2-エトキシカルボニル-3-メチルキノキサリン-1-オキド35gを得た。m. p. 85-87℃。

【0805】参考例19

2-エトキシカルボニル-3-メチルキノキサリン-4-オキシド 4.0 g をメタノール 80 ml 及び 5N-水酸化ナトリウム水溶液 10 ml に懸濁し、室温で 3 時間攪拌した。メタノールを留去し、残渣に水を加え溶解後、水層を酢酸エチルで洗浄し、塩酸酸性として析出物を回収、水洗、乾燥し、白色粉末として 3.2 g の 2-カルボキシ-3-メチルキノキサリン-4-オキシドを得た。m. p. 143~145°C (分解)。

【0806】参考例 20

2-カルボキシキノキサリン 2.0 g をメタノール 20 ml に溶解し、塩化チオニル 1.3 ml を氷冷下滴下した。15 分還流後メタノールを留去し、残渣をクロロホルム抽出し、飽和重曹水で洗浄後無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を留去し、得られた 2-メトキシカルボニルキノキサリンを塩化メチレン 40 ml に溶解し、室温攪拌下メタクロル過安息香酸 2.9 g を加え、一夜室温で攪拌した。反応液を希チオ硫酸ナトリウム水溶液、飽和重曹水で洗浄し無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を留去し、残渣に n-ヘキサンを加え結晶化後、回収、乾燥し、黄色粉末として 2-メトキシカルボニルキノキサリン-4-オキシドを 2.0 g 得た。m. p. 154~155°C。

【0807】参考例 21

2-エトキシカルボニル-3-メチルキノキサリン 2.

2 g を四塩化炭素 40 ml に溶かし、N-ブロモコハク酸イミド 2.7 g 及び過安息香酸 0.2 g を加え、8 時間加熱還流した。溶媒留去後、水を加え、ジクロロメタンで抽出した。無水硫酸ナトリウムで乾燥後溶媒を留去した。得られた残渣をイソプロパノール 50 ml に溶かし、イミダゾール 2.8 g を加え、10 時間加熱還流した。溶媒留去後、水を加え、クロロホルムで抽出し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒留去後、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒: ジクロロメタン: メタノール = 16:1) に付し、黄色粉末の 2-エトキシカルボニル-3-(1-イミダゾリル)メチルキノキサリン 1.33 g を得た。

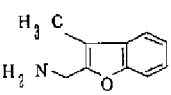
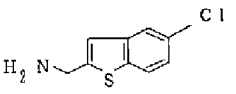
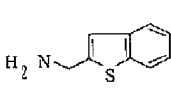
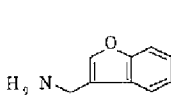
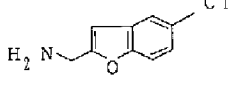
【0808】¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm:

1.47 (3H, t, J=7Hz), 4.55 (2H, q, J=7Hz), 5.82 (2H, s), 7.04 (2H, d, J=5Hz), 7.70 (1H, s), 7.8-8.0 (2H, m), 8.0-8.1 (1H, m), 8.2-8.3 (1H, m)。

【0809】適当な出発原料を用い、前記参考例 3、9、11 及び 14 と同様にして下記表 1~表 16 に示す No. 1~No. 70 の化合物を得た。

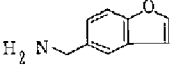
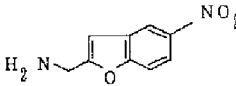
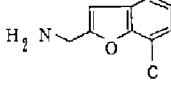
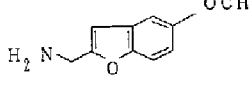
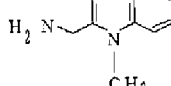
【0810】

【表 1】

No	構 造	m.p. °C	形 状	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm:
1			無色油状	1.55 (2H, brs), 2.21 (3H, s), 3.93 (2H, s), 7.15-7.30 (2H, m), 7.35-7.50 (2H, m)
2			黄色粉末状	1.31 (2H, brs), 4.14 (2H, s), 7.07 (1H, s), 7.2-7.3 (1H, m), 7.6-7.7 (2H, m)
3		65	黄色粉末状	1.61 (2H, brs), 4.15 (2H, s), 7.14 (1H, s), 7.25-7.40 (2H, m), 7.72 (1H, d, J=8Hz), 7.82 (1H, d, J=8Hz)
4			淡黄色油状	1.27 (2H, brs), 4.01 (2H, s), 7.20-7.40 (2H, m), 7.50 (1H, d, J=8Hz), 7.55 (1H, s), 7.60 (1H, d, J=8Hz)
5			淡黄色油状	1.56 (2H, brs), 3.97 (2H, s), 6.48 (1H, s), 7.20 (1H, d, J=8Hz), 7.34 (1H, d, J=8Hz), 7.48 (1H, s)

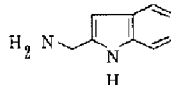
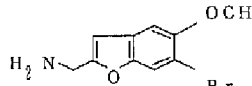
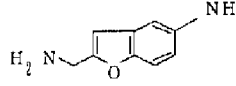
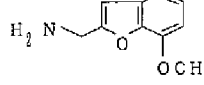
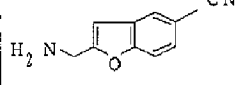
【0811】

【表 2】

No	構 造	mp ℃	形 状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:
6			淡黄色油状	1.54 (2H, brs), 3.95 (2H, s), 6.74 (1H, d, $J=2\text{Hz}$), 7.25 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.49 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.54 (1H, s), 7.63 (1H, d, $J=2\text{Hz}$)
7			黄色粉末状	1.58 (2H, brs), 4.04 (2H, s), 6.69 (1H, s), 7.50 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 8.21 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 8.46 (1H, s)
8			淡黄色油状	1.61 (2H, brs), 4.01 (2H, s), 6.58 (1H, s), 7.13 (1H, m), 7.25 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.42 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)
9			淡黄色油状	1.56 (2H, brs), 3.83 (3H, s), 3.94 (2H, s), 6.46 (1H, s), 6.84 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 6.98 (1H, s), 7.31 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)
10			黄色粉末状	1.49 (2H, brs), 3.75 (3H, s), 4.03 (2H, s), 6.38 (1H, s), 7.04-7.24 (2H, m), 7.30 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.58 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)

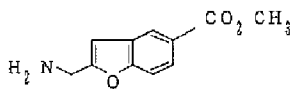
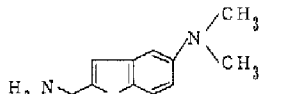
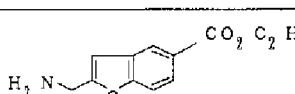
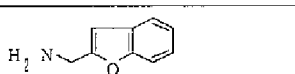
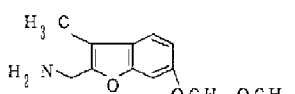
【0812】

【表3】

No	構 造	mp ℃	形 状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:
11			黄色粉末状	1.58 (2H, brs), 4.06 (2H, s), 6.32 (1H, s), 7.03-7.20 (2H, m), 7.34 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.54 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 8.50 (1H, brs)
12			淡黄色粉末状	1.54 (2H, brs), 3.91 (3H, s), 3.94 (2H, s), 6.46 (1H, s), 7.01 (1H, s), 7.63 (1H, s)
13			黄色粉末状	1.51 (2H, brs), 3.56 (2H, brs), 3.91 (2H, s), 6.36 (1H, s), 6.62 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 6.79 (1H, s), 7.22 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)
14			淡黄色油状	1.57 (2H, brs), 3.98 (2H, s), 4.01 (3H, s), 6.52 (1H, s), 6.74-6.83 (1H, m), 7.08-7.18 (2H, m)
15			淡黄色粉末状	4.02 (2H, s), 6.61 (1H, s), 7.52 (2H, brs), 7.86 (1H, brs)

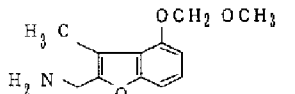
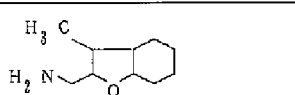
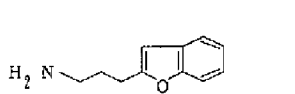
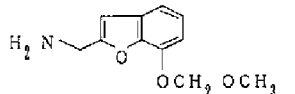
【0813】

【表4】

No	構 造	mp ℃	形 状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:
16			黄色粉末状	3.94 (3H, s), 4.00 (2H, s), 6.60 (1H, s), 7.45 (1H, d, J=9Hz), 7.98 (1H, d, J=9Hz), 8.26 (1H, s)
17			淡黄色油状	1.56 (2H, brs), 2.93 (6H, s), 3.93 (2H, s), 6.42 (1H, s), 6.80 (1H, d, J=8Hz), 6.85 (1H, s), 7.34 (1H, d, J=8Hz)
18			淡黄色油状	1.42 (3H, t, J=7Hz), 1.53 (2H, brs), 4.00 (2H, s), 4.40 (2H, q, J=7Hz), 6.60 (1H, s), 7.47 (1H, d, J=8Hz), 8.00 (1H, d, J=8Hz), 8.26 (1H, s)
19			淡黄色油状	1.57 (2H, brs), 3.97 (2H, s), 7.15-7.30 (2H, m), 7.44 (1H, d, J=7Hz), 7.52 (1H, d, J=7Hz)
20			淡黄色油状	1.52 (2H, brs), 2.18 (2H, s), 3.05 (3H, s), 3.89 (2H, s), 5.20 (2H, s), 6.95 (1H, d, J=8Hz), 7.14 (1H, s), 7.32 (1H, d, J=8Hz)

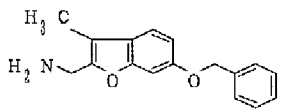
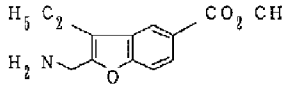
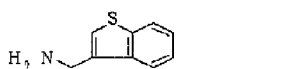
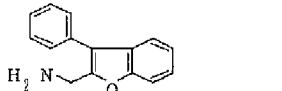
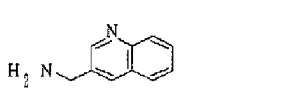
【0814】

【表5】

No	構 造	mp ℃	形 状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:
21			淡黄色油状	1.51 (2H, brs), 2.34 (2H, s), 3.52 (3H, s), 3.89 (2H, s), 5.28 (2H, s), 6.81 (1H, d, J=8Hz), 7.05-7.16 (2H, m)
22			無色油状	0.92 (3H, t, J=7Hz), 1.08-1.18 (2H, m), 1.40-2.05 (9H, m), 2.45-2.62 (1H, m), 2.62-2.90 (2H, m), 3.80-3.95 (2H, m)
23			淡黄色油状	1.92 (2H, m), 2.82 (2H, t, J=7Hz), 2.84 (2H, t, J=7Hz), 6.41 (1H, s), 7.13-7.25 (2H, m), 7.35-7.50 (2H, m)
24			淡黄色油状	1.83 (2H, brs), 3.56 (3H, s), 3.40 (2H, s), 5.37 (2H, s), 6.55 (1H, s), 7.04 (1H, d, J=8Hz), 7.05-7.21 (2H, m)

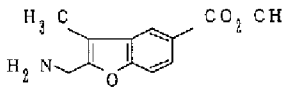
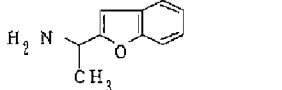
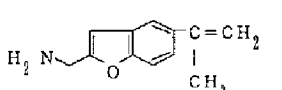
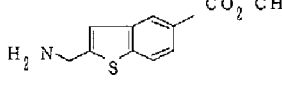
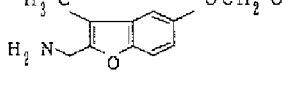
【0815】

【表6】

No	構 造	mp ℃	形 状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:
25			白色粉末状	1.51 (2H, brs), 2.17 (3H, s), 3.89 (2H, s), 5.10 (2H, s), 6.94 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.02 (1H, s), 7.27-7.50 (6H, m)
26			淡黄色油状	1.26 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 2.92 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 3.95 (3H, s), 4.24 (2H, s), 7.41 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 8.00 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 8.25 (1H, s)
27			黄色油状	1.89 (2H, brs), 4.13 (2H, s), 7.2-7.5 (3H, m), 7.7-7.9 (2H, m)
28			淡黄色油状	1.97 (2H, brs), 4.05 (2H, s), 7.2-7.6 (9H, m)
29			褐色油状	1.59 (2H, brs), 4.10 (2H, s), 7.54 (1H, dd, $J=8\text{Hz}$, $J=8\text{Hz}$), 7.69 (1H, dd, $J=8\text{Hz}$, $J=8\text{Hz}$), 7.80 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 8.0-8.2 (2H, m), 8.89 (2H, s)

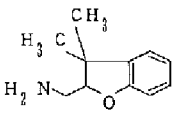
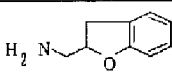
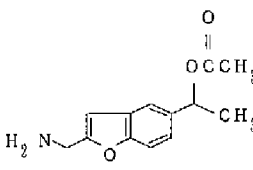
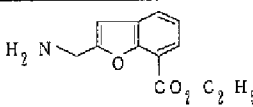
【0816】

【表7】

No	構 造	mp ℃	形 状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:
30			淡黄色油状	2.27 (3H, s), 3.97 (3H, s), 4.52 (2H, d, $J=6\text{Hz}$), 7.42 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.98 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 8.20 (1H, s)
31			無色油状	1.52 (3H, d, $J=6\text{Hz}$), 1.83 (2H, brs), 4.20 (1H, q, $J=8\text{Hz}$), 6.50 (1H, s), 7.15-7.30 (2H, m), 7.43 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.51 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)
32			淡黄色油状	2.20 (3H, brs), 4.00 (2H, s), 5.08 (1H, s), 5.34 (1H, brs), 6.52 (1H, s), 7.38 (2H, s), 7.56 (1H, s)
33			白色粉末状	1.64 (2H, brs), 3.95 (3H, s), 4.17 (2H, s), 7.21 (1H, s), 7.84 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.94 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 8.40 (1H, s)
34			淡黄色油状	1.60 (2H, brs), 2.18 (3H, s), 3.51 (3H, s), 3.91 (2H, s), 5.20 (2H, s), 6.95 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.10 (1H, s), 7.29 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)

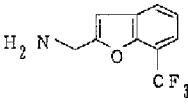
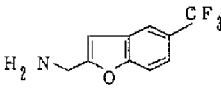
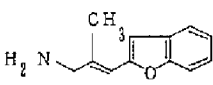
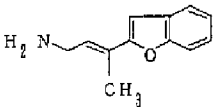
【0817】

【表8】

No	構 造	mp °C	形 状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:
35			黄色油状	1. 14 (3H, s), 1. 44 (3H, s), 2. 8-3. 1 (2H, m), 4. 2-4. 3 (1H, m), 6. 7-7. 2 (4H, m)
36			黄色油状	1. 35 (2H, brs), 2. 8-3. 1 (3H, m), 3. 2-3. 4 (1H, m), 4. 7-4. 9 (1H, m), 6. 7-6. 9 (2H, m), 7. 0-7. 2 (2H, m)
37			淡黄色油状	1. 57 (3H, d, J=8Hz), 1. 79 (2H, brs), 2. 07 (3H, s), 3. 97 (2H, s), 5. 97 (1H, q, J=8Hz), 6. 52 (1H, s), 7. 25 (3H, d, J=8Hz), 7. 40 (1H, d, J=8Hz), 7. 52 (1H, s)
38			淡褐色油状	1. 45 (3H, t, J=7Hz), 1. 74 (2H, s), 4. 05 (2H, s), 4. 46 (2H, q, J=7Hz), 6. 58 (1H, s), 7. 20-7. 35 (1H, m), 7. 70 (1H, d, J=8Hz), 7. 89 (1H, d, J=8Hz)

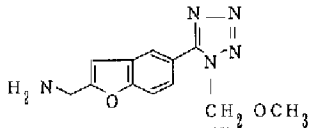
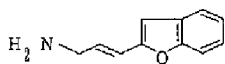
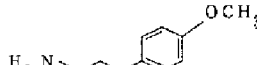
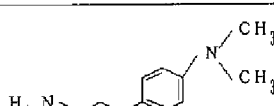
【0818】

【表9】

No	構 造	mp °C	形 状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:
39			淡褐色油状	1. 60 (2H, brs), 4. 03 (2H, s), 6. 61 (1H, s), 7. 20-7. 35 (1H, m), 7. 48 (1H, d, J=8Hz), 7. 69 (1H, d, J=8Hz)
40			淡褐色油状	1. 56 (2H, brs), 4. 01 (2H, s), 6. 60 (1H, s), 7. 50 (2H, s), 7. 81 (1H, s)
41			淡黄色油状	2. 14 (3H, s), 3. 43 (2H, s), 6. 39 (1H, brs), 6. 59 (1H, s), 7. 15-7. 25 (2H, m), 7. 40-7. 50 (2H, m)
42			淡黄色油状	2. 04 (3H, s), 3. 54 (2H, d, J=7Hz), 6. 44 (1H, t, J=7Hz), 6. 60 (1H, s), 7. 15-7. 30 (2H, m), 7. 46 (1H, d, J=7Hz), 7. 51 (1H, d, J=7Hz)

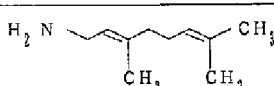
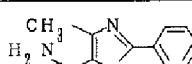
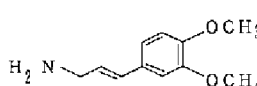
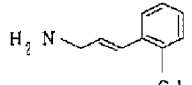
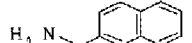
【0819】

【表10】

No	構 造	mp ℃	形 状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:
43	 (メチルベンジミダゾールの2位に dimethylamino 基、4位に methoxymethyl 基)		淡黄色油状	3.53及び3.60 (3H, s), 4.02及び4.04 (2H, s), 5.89及び5.72 (2H, s), 6.62及び6.66 (1H, s), 7.54及び7.62 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 8.00及び8.02 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 8.37 (1H, s)
44			淡黄色油状	3.54 (2H, d, $J=5\text{Hz}$), 6.43-6.63 (3H, m), 7.13-7.30 (2H, m), 7.40-7.55 (2H, m)
45			淡黄色油状	1.39 (2H, brs), 1.67-1.80 (2H, m), 2.60 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 2.72 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 3.79 (3H, s), 6.82 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.09 (2H, d, $J=8\text{Hz}$)
46			淡黄色油状	1.28 (2H, brs), 1.15-1.30 (2H, m), 2.56 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 2.72 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 2.91 (6H, s), 6.69 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.07 (2H, d, $J=8\text{Hz}$)

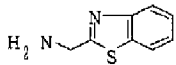
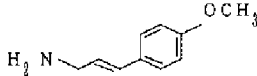
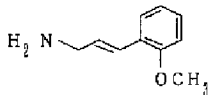
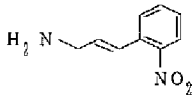
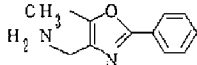
【0820】

【表11】

No	構 造	mp ℃	形 状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:
47			淡褐色油状	1.27 (2H, brs), 1.61 (3H, s), 1.63 (3H, s), 1.71 (3H, s), 1.95-2.15 (4H, m), 3.27 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 5.05-5.15 (1H, m), 5.20-5.31 (1H, m)
48			褐色油状	2.50 (3H, s), 3.90 (2H, s), 7.3-7.5 (3H, m), 7.8-8.0 (2H, m)
49			黄色油状	1.26 (2H, br), 3.49 (2H, d, $J=6\text{Hz}$), 3.88 (3H, s), 3.90 (3H, s), 6.2-6.3 (1H, m), 6.42 (1H, d, $J=16\text{Hz}$), 6.82 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 6.9-7.0 (2H, m)
50			黄色油状	1.30 (2H, br), 3.53 (2H, d, $J=6\text{Hz}$), 6.2-6.4 (1H, m), 6.90 (1H, d, $J=16\text{Hz}$), 7.1-7.3 (2H, m), 7.3-7.5 (2H, m)
51			淡褐色粉末状	1.53 (2H, brs), 4.03 (2H, s), 7.35-7.50 (3H, m), 7.70-7.92 (4H, m)

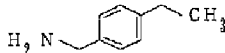
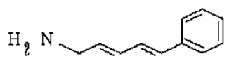
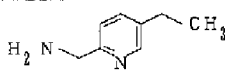
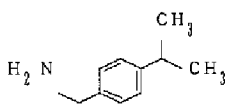
【0821】

【表12】

No	構 造	mp ℃	形 状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:
52			褐色油状	1. 78 (2H, brs), 4. 31 (2H, s), 7. 30-7. 50 (2H, m), 7. 88 (1H, d, $J=7\text{Hz}$), 7. 97 (1H, d, $J=7\text{Hz}$)
53			黄色油状	1. 30 (2H, brs), 3. 45 (2H, d, $J=6\text{Hz}$), 3. 81 (3H, s), 6. 0-6. 2 (1H, m), 6. 48 (1H, d, $J=16\text{Hz}$), 6. 82 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 20 (2H, d, $J=8\text{Hz}$)
54			黄色油状	1. 25 (2H, br), 3. 48 (2H, d, $J=6\text{Hz}$), 3. 86 (3H, s), 6. 3-6. 5 (1H, m), 6. 7-6. 9 (3H, m), 7. 20 (1H, m), 7. 42 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)
55			褐色油状	1. 36 (2H, brs), 3. 54 (2H, d, $J=6\text{Hz}$), 6. 2-6. 4 (1H, m), 6. 98 (1H, d, $J=16\text{Hz}$), 7. 37 (1H, m), 7. 5-7. 7 (2H, m), 7. 90 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)
56			白色粉末状	2. 37 (3H, s), 3. 74 (2H, s), 7. 4-7. 5 (3H, m), 7. 85-8. 05 (2H, m)

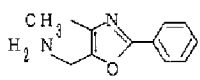
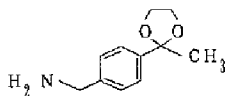
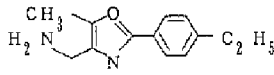
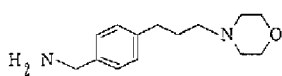
【0822】

【表13】

No	構 造	mp ℃	形 状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:
57			黄色油状	1. 23 (2H, t, $J=8\text{Hz}$), 1. 49 (2H, brs), 2. 63 (2H, q, $J=8\text{Hz}$), 3. 82 (2H, s), 7. 16 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 22 (2H, d, $J=8\text{Hz}$)
58			淡黄色油状	1. 39 (2H, brs), 3. 40 (2H, d, $J=6\text{Hz}$), 5. 85-6. 00 (1H, m), 6. 32 (1H, dd, $J=16\text{Hz}$, 10Hz), 6. 52 (1H, d, $J=16\text{Hz}$), 6. 78 (1H, dd, $J=16\text{Hz}$, 10Hz), 7. 15-7. 42 (5H, m)
59			褐色油状	1. 24 (3H, t, $J=8\text{Hz}$), 1. 91 (2H, brs), 2. 64 (2H, q, $J=8\text{Hz}$), 3. 94 (2H, s), 7. 19 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 48 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 8. 40 (1H, s)
60			無色油状 bp80℃/ 0.3 mmHg	7. 24 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 20 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 3. 83 (2H, s), 2. 90 (1H, sep, $J=7\text{Hz}$), 1. 40 (2H, br), 1. 25 (6H, d, $J=7\text{Hz}$)

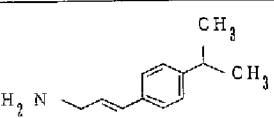
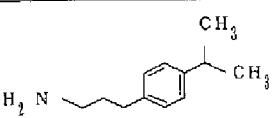
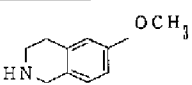
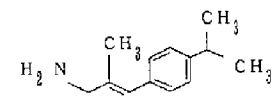
【0823】

【表14】

No	構 造	mp ℃	形 状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:
61			白色粉末状	2.22 (3H, s), 3.92 (2H, s), 7.4-7.5 (3H, m), 8.0-8.05 (2H, m)
62			無色油状	7.45 (2H, d, J=8Hz), 7.29 (2H, d, J=8Hz), 4.04 (2H, m), 3.87 (2H, s), 3.77 (2H, m), 1.77 (2H, br), 1.65 (3H, s)
63			淡黄色粉末状	1.20 (3H, t, J=8Hz), 2.35 (3H, s), 2.65 (2H, q, J=8Hz), 2.82 (2H, brs), 3.58 (2H, s), 7.33 (2H, d, J=8Hz), 8.06 (2H, d, J=8Hz)
64			黄色油状	1.62 (2H, brs), 1.7-1.9 (2H, m), 2.3-2.5 (6H, m), 2.63 (2H, t, J=8Hz), 3.72 (4H, t, J=5Hz), 3.83 (2H, s), 7.15 (2H, d, J=8Hz), 7.23 (2H, d, J=8Hz)

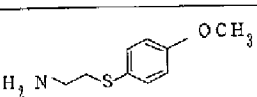
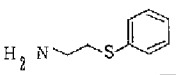
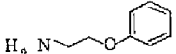
【0824】

【表15】

No	構 造	mp ℃	形 状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:
65			無色油状	7.29 (2H, d, J=8Hz), 7.16 (2H, d, J=8Hz), 6.48 (1H, d, J=16Hz), 6.28 (1H, dt, J=16Hz, 6Hz), 3.47 (2H, d, J=6Hz), 2.88 (1H, sep, J=7Hz), 1.72 (2H, br), 1.23 (6H, d, J=7Hz)
66			無色油状	7.15 (2H, d, J=8Hz), 7.11 (2H, d, J=8Hz), 2.88 (1H, sep, J=7Hz), 2.74 (2H, t, J=7Hz), 2.63 (2H, t, J=7Hz), 1.77 (2H, qui, J=7Hz), 1.24 (6H, d, J=7Hz), 1.55 (2H, br)
67			淡黄色油状	2.77 (2H, t, J=6Hz), 3.12 (2H, t, J=6Hz), 3.78 (3H, s), 3.95 (2H, s), 6.63 (1H, brs), 6.69 (1H, brd, J=8Hz), 6.92 (1H, d, J=8Hz)
68			無色油状	7.20 (4H, s), 6.41 (1H, brs), 3.39 (2H, s), 2.90 (1H, sep, J=7Hz), 2.09 (2H, br), 1.91 (3H, brs), 1.25 (6H, d, J=7Hz)

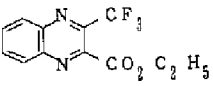
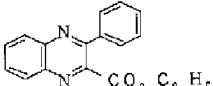
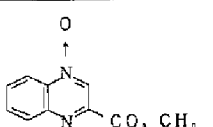
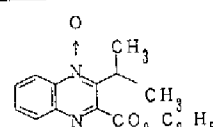
【0825】

【表16】

No	構 造	mp ℃	形 状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:
69			無色油状	1.38 (2H, brs), 2.80-2.95 (4H, m), 3.80 (3H, s), 6.84 (2H, d, J=8Hz), 7.38 (2H, d, J=8Hz)
70			無色油状	1.38 (2H, brs), 2.80-2.90 (2H, m), 2.90-3.05 (2H, m), 7.10-7.40 (5H, m)
71			無色油状	1.47 (2H, brs), 3.08 (2H, t, J=5Hz), 4.01 (2H, t, J=5Hz), 6.85-7.00 (3H, m), 7.25-7.35 (2H, m)

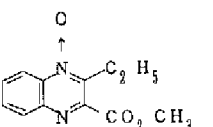
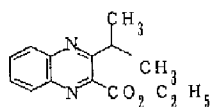
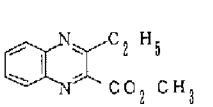
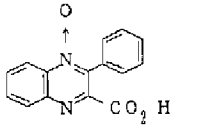
【0826】適当な出発原料を用い、前記参考例15～21と同様にして下記表17～表21に示すNo. 1～No. 18の化合物を得た。

【0827】
【表17】

No	構 造	mp ℃	形 状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:
1			淡黄色粉末状	1. 48 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 4. 58 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 7. 95-8. 05 (2H, m), 8. 20-8. 32 (2H, m)
2		64 ~ 65	淡黄色粉末状	1. 18 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 4. 34 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 7. 45-7. 55 (3H, m), 7. 70-7. 80 (2H, m), 7. 80-7. 90 (2H, m), 8. 15-8. 25 (2H, m)
3		154 ~ 155	黄色粉末状	4. 12 (3H, s), 7. 80-7. 95 (2H, m), 8. 34 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 8. 61 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 9. 04 (1H, s)
4			淡黄色粉末状	1. 48 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1. 52 (6H, d, $J=8\text{Hz}$), 3. 6-3. 8 (1H, m), 4. 54 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 7. 7-7. 9 (2H, m), 8. 0-8. 2 (1H, m), 8. 5-8. 6 (1H, m)

【0828】

【表18】

No	構 造	mp ℃	形 状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:
5			黄色粉末状	1. 38 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 3. 27 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 4. 09 (3H, s), 7. 7-7. 9 (2H, m), 8. 1-8. 3 (1H, m), 8. 5-8. 7 (1H, m)
6			黄色粉末状	1. 42 (3H, d, $J=7\text{Hz}$), 1. 49 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 3. 6-3. 8 (1H, m), 4. 56 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 7. 7-7. 9 (2H, m), 8. 0-8. 2 (2H, m)
7			淡褐色粉末状	1. 43 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 3. 30 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 4. 09 (3H, s), 7. 7-7. 9 (2H, m), 8. 09 (1H, dd, $J=2\text{Hz}$, 8Hz), 8. 18 (1H, dd, $J=2\text{Hz}$, 8Hz)
8			淡黄色粉末状	DMSO- d_6 7. 45-7. 60 (5H, m), 7. 85-8. 05 (2H, m), 8. 21 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 8. 48 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)

【0829】

【表19】

No	構 造	mp ℃	形 状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:
9		106 ~ 108	淡黄色粉末状	1. 03 (3H, t, J=7Hz), 4. 18 (2H, q, J=7Hz), 7. 45-7. 60 (5H, m), 7. 75-7. 95 (2H, m), 8. 25 (1H, d, J=8Hz), 8. 64 (1H, d, J=8Hz)
10			黄色鱗片状 (ジイソプロ ピルエーテ ル)	1. 49 (3H, t, J=7Hz), 2. 78 (3H, s), 4. 56 (2H, q, J=7Hz), 7. 73 (1H, dd, J=2Hz, 9Hz), 8. 18 (1H, d, J=2Hz), 8. 53 (1H, d, J=9Hz)
11			黄色油状	1. 49 (3H, t, J=7Hz), 3. 0-3. 2 (4H, m), 3. 8-4. 0 (4H, m), 4. 56 (2H, q, J=7Hz), 4. 56 (2H, s), 7. 8-7. 9 (2H, m), 8. 0-8. 1 (1H, m), 8. 2-8. 3 (1H, m)

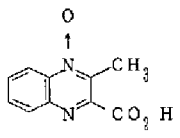
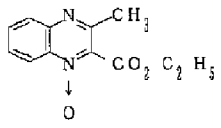
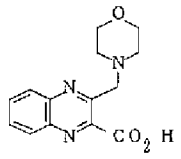
【0830】

【表20】

No	構 造	mp ℃	形 状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:
12			黄色粉末状	1. 47 (3H, t, J=7Hz), 4. 55 (2H, q, J=7Hz), 5. 82 (2H, s), 7. 04 (2H, d, J=5Hz), 7. 70 (1H, s), 7. 8-8. 0 (2H, m), 8. 0-8. 1 (1H, m), 8. 2-8. 3 (1H, m)
13		91 ~ 93	無色針状 (n-ヘキサ ン-ジエチ ルエーテル)	1. 49 (3H, t, J=7Hz), 2. 81 (3H, s), 4. 56 (2H, q, J=7Hz), 7. 75-7. 85 (2H, m), 8. 15-8. 25 (1H, m), 8. 55-8. 65 (1H, m)
14		74 ~ 75	無色針状 (n-ペンタ ン)	1. 50 (3H, t, J=7Hz), 2. 96 (3H, s), 4. 57 (2H, q, J=7Hz), 7. 70-7. 90 (2H, m), 8. 05 (1H, d, J=8Hz), 8. 19 (1H, d, J=8Hz)
15		137 ~ 138	淡黄色針状 (酢酸エチル)	1. 48 (3H, t, J=7Hz), 2. 60 (3H, s), 4. 59 (2H, q, J=7Hz), 7. 30-7. 46 (2H, m), 8. 53-8. 67 (2H, m)

【0831】

【表21】

No	構 造	mp ℃	形 状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:
16		143 ~ 145 (dec)	白色粉末状	2. 87 (3H, s), 7. 75-7. 90 (2H, m), 8. 15-8. 25 (1H, m), 8. 54-8. 65 (1H, m)
17		85 ~ 87	無色プリズム状 (n-ヘキサ ン-酢酸 エチル)	1. 50 (3H, t, J=7Hz), 2. 68 (3H, s), 4. 58 (2H, q, J=7Hz), 7. 65-7. 90 (2H, m), 8. 04 (1H, d, J=8Hz), 8. 53 (1H, d, J=8Hz)
18			黄色粉末状	3. 0-3. 2 (4H, m), 3. 9-4. 0 (4H, m), 4. 56 (2H, s), 7. 8-7. 9 (2H, m), 8. 0-8. 1 (1H, m), 8. 2-8. 3 (1H, m)

【0832】適当な出発原料を用い、前記参考例3、9、11及び14と同様にして下記表22～表63に示すNo. 1～No. 126の化合物を得た。

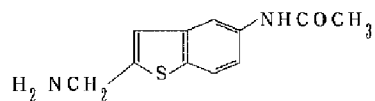
【0833】
【表22】

No. 1	
構造	
形状	淡黄色固体
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	
1. 61 (2H, br), 2. 23 (3H, s), 3. 95 (5H, s), 4. 05 (3H, s), 7. 50 (1H, s), 7. 85 (1H, s)	
No. 2	
構造	
形状	淡褐色固体
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	
1. 56 (2H, br), 2. 87 (3H, s), 3. 36 (3H, s), 3. 98 (2H, s), 6. 53 (1H, s), 7. 24 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7. 43 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7. 54 (1H, s)	
No. 3	
構造	
形状	淡黄色油状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	
1. 43 (2H, br), 2. 47 (3H, s), 3. 95 (2H, s), 7. 40-7. 60 (2H, m), 7. 85 (1H, s)	

No. 4	
構造	
形状	淡黄色油状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :	1. 44 (2H, br), 2. 50 (3H, s), 3. 94 (2H, s), 7. 20-7. 35 (1H, m), 7. 45 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7. 75 (1H, d, $J=9\text{Hz}$)
No. 5	
構造	
形状	淡黄色油状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :	1. 12 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1. 67 (2H, br), 1. 82 (3H, s), 3. 77 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 4. 01 (2H, s), 6. 56 (1H, s), 7. 03 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7. 30 (1H, s), 7. 46 (1H, d, $J=9\text{Hz}$)
No. 6	
構造	
形状	黄色粉末状
$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm :	2. 18 (3H, s), 4. 13 (2H, s), 7. 43 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7. 63 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 8. 38 (1H, s), 9. 42 (1H, br)

No. 7

構造



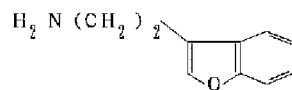
形状 白色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 60 (2H, br), 2. 21 (3H, s), 4. 13 (2H, s),
 7. 09 (1H, s), 7. 15-7. 30 (2H, m), 7. 70
 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 8. 03 (1H, s)

No. 8

構造



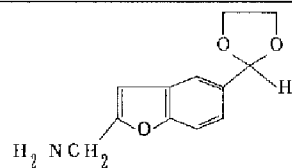
形状 淡褐色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 56 (2H, br), 2. 83 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 3. 05
 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 7. 20-7. 40 (2H, m), 7. 40
 -7. 65 (3H, m)

No. 9

構造



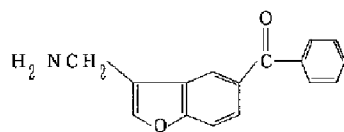
形状 淡褐色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 58 (2H, br), 3. 97 (2H, s), 4. 00-4. 25
 (4H, m), 5. 89 (1H, s), 6. 53 (1H, s), 7. 37
 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 44 (1H, d, $J=8\text{Hz}$),
 7. 65 (1H, s)

No. 10

構造



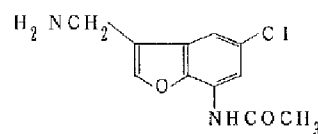
形状 淡黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.54 (2H, br), 4.04 (2H, s), 7.45-7.70 (5H, m), 7.75-7.90 (3H, m), 8.12 (1H, s)

No. 11

構造



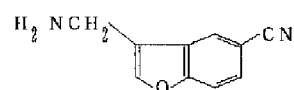
形状 白色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.48 (2H, br), 2.27 (3H, s), 3.97 (2H, s), 7.31 (1H, s), 7.55 (1H, s), 7.61 (1H, br), 8.25 (1H, s)

No. 12

構造



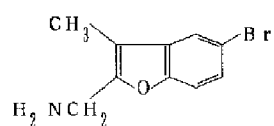
形状 淡黄色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.48 (2H, br), 4.04 (2H, s), 7.50-7.65 (2H, m), 7.68 (1H, s), 8.01 (1H, s)

No. 13

構造

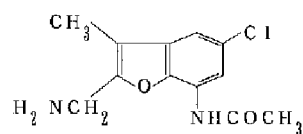


形状 橙色固体

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:1. 58 (2H, br), 2. 17 (3H, s), 3. 92 (2H, s),
7. 20-7. 40 (2H, m), 7. 57 (1H, s)

No. 14

構造

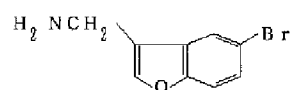


形状 淡黄色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:1. 58 (2H, br), 2. 17 (3H, s), 2. 27 (3H, s),
3. 95 (2H, s), 7. 15 (1H, s), 7. 70 (1H, br),
8. 21 (1H, s)

No. 15

構造

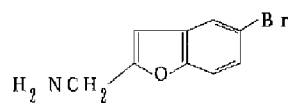


形状 淡黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:1. 51 (2H, br), 3. 97 (2H, s), 7. 30-7. 45
(2H, m), 7. 55 (1H, s), 7. 75 (1H, s)

No. 16

構造

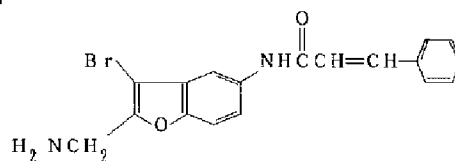


形状 淡黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:1. 58 (2H, br), 3. 97 (2H, s), 6. 53 (1H, s),
7. 20-7. 60 (3H, m)

No. 17

構造

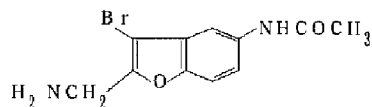


形状 淡褐色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:1. 61 (2H, br), 4. 00 (2H, s), 6. 58 (1H, d,
 $J=16\text{Hz}$), 7. 30-7. 90 (10H, m)

No. 18

構造

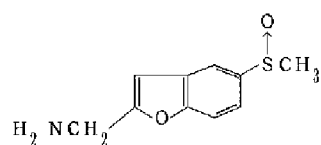


形状 淡褐色固体

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:1. 61 (2H, br), 2. 20 (3H, s), 4. 00 (2H, s),
7. 35 (2H, s), 7. 46 (1H, br), 7. 68 (1H, s)

No. 19

構造



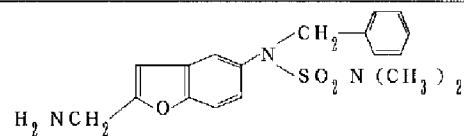
形状 淡黄色固体

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 61 (2H, br), 2. 75 (3H, s), 4. 01 (2H, s),
6. 62 (1H, s), 7. 49 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7. 57
(1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7. 89 (1H, s)

No. 20

構造



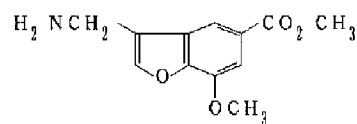
形状 淡赤色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 57 (2H, s), 2. 74 (6H, s), 3. 94 (2H, s),
4. 78 (2H, s), 6. 46 (1H, s), 7. 00 (1H, d,
 $J=9\text{Hz}$), 7. 15-7. 32 (5H, m), 7. 32 (1H, d,
 $J=9\text{Hz}$), 7. 41 (1H, s)

No. 21

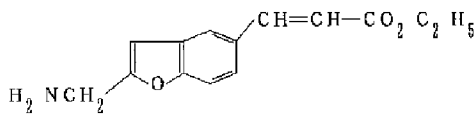
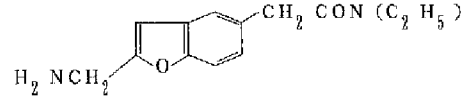
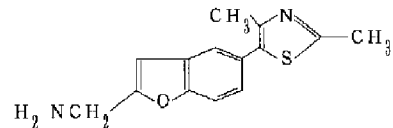
構造



形状 淡黄色油状

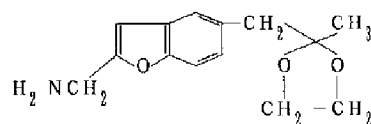
 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 57 (2H, s), 3. 95 (3H, s), 4. 03 (2H, s),
4. 05 (3H, s), 7. 53 (1H, s), 7. 62 (1H, s),
7. 97 (1H, s)

<p>No. 22</p> <p>構造</p>  <p>形状 白色固体</p> <p>$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:</p> <p>1.35 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.60 (2H, br), 3.99 (2H, s), 4.27 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 6.41 (1H, d, $J=16\text{Hz}$), 6.55 (1H, s), 7.40 (2H, m), 7.68 (1H, s), 7.77 (1H, d, $J=16\text{Hz}$)</p>	<p>No. 23</p> <p>構造</p>  <p>形状 淡褐色油状</p> <p>$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:</p> <p>1.00-1.20 (6H, m), 1.58 (2H, br), 3.20-3.45 (4H, m), 3.76 (2H, s), 3.96 (2H, s), 6.47 (1H, s), 7.13 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.37 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.41 (1H, s)</p>	<p>No. 24</p> <p>構造</p>  <p>形状 褐色油状</p> <p>$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:</p> <p>1.57 (2H, br), 2.45 (3H, s), 2.69 (3H, s), 3.96 (2H, s), 6.47 (1H, s), 7.10 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.30-7.55 (2H, m)</p>
---	--	---

No. 25

構造



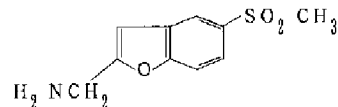
形状 無色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.32 (3H, s), 1.57 (2H, br), 2.99 (2H, s),
 3.70-3.95 (4H, m), 3.96 (2H, s), 6.48
 (1H, s), 7.16 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.34 (1H, d,
 $J=8\text{Hz}$), 7.41 (1H, s)

No. 26

構造



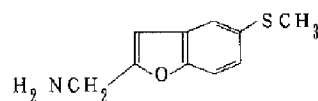
形状 白色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.60 (2H, br), 3.09 (3H, s), 4.04 (2H, s),
 6.67 (1H, s), 7.58 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.84
 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 8.16 (1H, s)

No. 27

構造



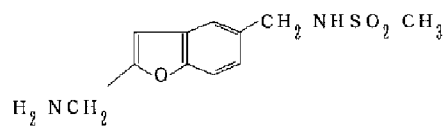
形状 白色固体

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.57 (2H, br), 2.51 (3H, s), 3.97 (2H, s),
 6.47 (1H, s), 7.22 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.35
 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.47 (1H, s)

No. 28

構造



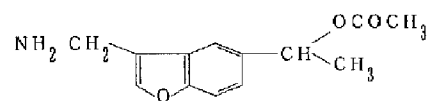
形状 淡黄色粉末状 (HCl)

 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm:

2.84 (3H, s), 4.24 (4H, s), 7.04 (1H, s), 7.33 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.57 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.64 (1H, s), 8.78 (1H, br)

No. 29

構造



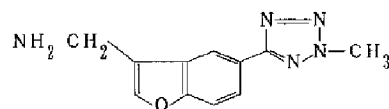
形状 淡黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl $_3$) δ ppm:

1.54 (2H, br), 1.59 (3H, d, $J=8\text{Hz}$), 2.07 (3H, s), 4.02 (2H, s), 6.00 (1H, q, $J=8\text{Hz}$), 7.32 (1H, d, $J=10\text{Hz}$), 7.45 (1H, d, $J=10\text{Hz}$), 7.56 (1H, s), 7.60 (1H, s)

No. 30

構造



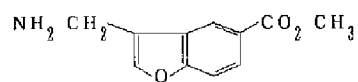
形状 白色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl $_3$) δ ppm:

1.53 (2H, br), 4.07 (2H, s), 4.41 (3H, s), 7.57 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.62 (1H, s), 8.11 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 8.41 (1H, s)

No. 31

構造



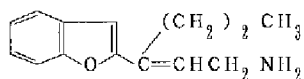
形状 淡黄色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.52 (2H, br), 3.95 (3H, s), 4.05 (2H, s),
 7.50 (1H, d, $J=10\text{Hz}$), 7.62 (1H, s), 8.04
 (1H, d, $J=10\text{Hz}$), 8.35 (1H, s)

No. 32

構造



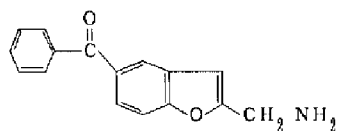
形状 淡黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

0.94 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.50-1.62 (2H, m),
 2.40-2.60 (2H, m), 3.55 (2H, d, $J=7\text{Hz}$),
 5.70 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 6.63 (1H, s), 7.17-
 7.29 (2H, m), 7.40-7.56 (2H, m)

No. 33

構造



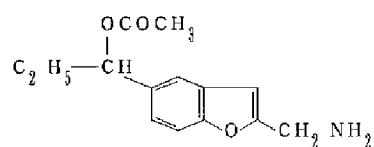
形状 淡黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

4.02 (2H, s), 6.61 (1H, s), 7.46-7.63
 (4H, m), 7.77-8.01 (3H, m), 8.01 (1H, s)

No. 34

構造



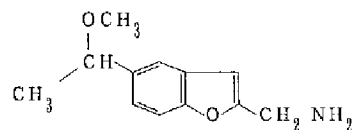
形状 淡黄色不定形

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

0.88 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.80-2.00 (2H, m),
2.07 (3H, s), 3.96 (1H, s), 5.73 (1H, t, $J=7\text{Hz}$),
6.51 (1H, s), 7.23 (1H, dd, $J=8\text{Hz}$, 2Hz),
7.39 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.48 (1H, d, $J=2\text{Hz}$)

No. 35

構造



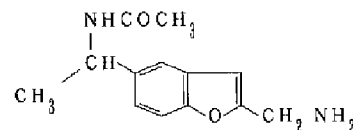
形状 無色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.47 (3H, d, $J=7\text{Hz}$), 3.22 (3H, s), 3.96
(2H, s), 4.37 (1H, q, $J=7\text{Hz}$), 6.51 (1H,
s), 7.20 (1H, dd, $J=8\text{Hz}$, 2Hz), 7.40 (1H,
d, $J=8\text{Hz}$), 7.45 (1H, d, $J=2\text{Hz}$)

No. 36

構造



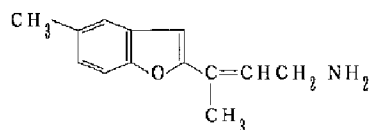
形状 黄色不定形

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.53 (3H, d, $J=7\text{Hz}$), 1.99 (3H, s), 3.96
(2H, s), 5.21 (1H, q, $J=7\text{Hz}$), 5.7 (1H,
br), 6.65 (1H, s), 7.23 (1H, d, $J=8\text{Hz}$),
7.40 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.50 (1H, s)

No. 37

構造



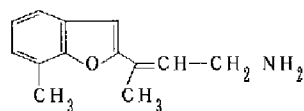
形状 淡黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :

2.02 (3H, s), 2.42 (3H, s), 3.53 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 6.41 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 6.52 (1H, s), 7.04 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.28 (1H, s), 7.30 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)

No. 38

構造



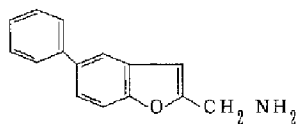
形状 淡黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :

2.04 (3H, s), 2.52 (3H, s), 3.55 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 6.47 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 6.58 (1H, s), 7.04 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.08 (1H, t, $J=8\text{Hz}$), 7.33 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)

No. 39

構造



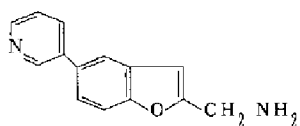
形状 淡黄色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :

3.99 (2H, s), 6.57 (1H, s), 7.30-7.48 (5H, m), 7.59-7.62 (2H, m), 7.71 (1H, s)

No. 40

構造



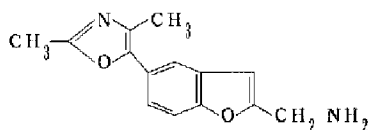
形状 淡黄色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :

4.02 (2H, s), 6.60 (1H, s), 7.34-7.55 (3H, m), 7.72 (1H, d, $J=5\text{Hz}$), 7.90 (1H, d, $J=7\text{Hz}$), 8.58 (1H, d, $J=5\text{Hz}$), 8.87 (1H, s,)

No. 41

構造



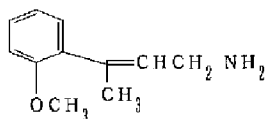
形状 淡黄色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :

2.39 (3H, s), 2.49 (3H, s), 4.00 (2H, s), 6.56 (1H, s), 7.47 (2H, s), 7.70 (1H, s)

No. 42

構造



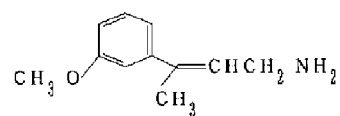
形状 淡黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :

2.00 (3H, s), 3.48 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 3.82 (3H, s), 5.55 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 6.85-6.93 (2H, m), 7.13 (1H, dd, $J=8\text{Hz}$, 2Hz), 7.22 (1H, dd, $J=8\text{Hz}$, 2Hz)

No. 43

構造



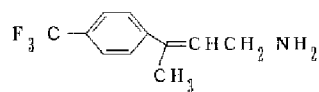
形状 無色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.04 (3H, s), 3.49 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 3.82 (3H, s), 5.86 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 6.79 (1H, dd, $J=8\text{Hz}$, 2Hz), 6.93 (1H, t, $J=2\text{Hz}$), 6.99 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.23 (1H, t, $J=8\text{Hz}$)

No. 44

構造



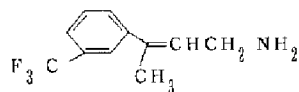
形状 無色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.06 (3H, s), 3.52 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 5.92 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 7.47-7.61 (4H, m)

No. 45

構造



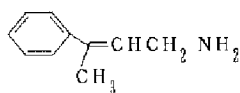
形状 無色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.07 (3H, s), 3.52 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 5.90 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 7.39-7.58 (3H, m), 7.63 (1H, s)

No. 46

構造

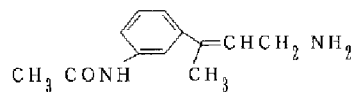


形状 無色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:2.06 (3H, s), 3.49 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 5.85 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 7.21-7.42 (5H, m)

No. 47

構造

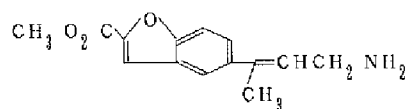


形状 淡黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:2.04 (3H, s), 2.18 (3H, s), 3.48 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 5.86 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 7.15 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.26 (1H, t, $J=8\text{Hz}$), 7.39 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.51 (1H, s), 7.20 (1H, br)

No. 48

構造

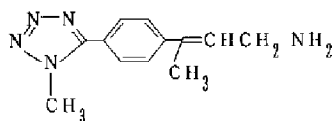


形状 黄色不定形

 $^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:2.05 (3H, s), 3.38 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 3.90 (3H, s), 5.86 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 7.50-7.78 (4H, m)

No. 49

構造



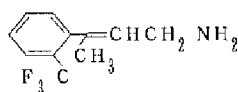
形状 白色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.09 (3H, s), 3.53 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 4.40 (3H, s), 5.96 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 7.53 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 8.09 (2H, d, $J=8\text{Hz}$)

No. 50

構造



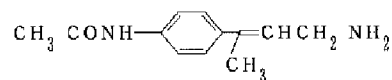
形状 無色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.97 (3H, s), 3.44 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 5.41 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 7.22 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.37 (1H, t, $J=8\text{Hz}$), 7.48 (1H, t, $J=8\text{Hz}$), 7.63 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)

No. 51

構造



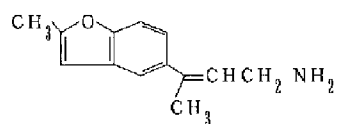
形状 無色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.03 (3H, s), 2.17 (3H, s), 3.48 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 5.83 (1H, d, $J=7\text{Hz}$), 7.35 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.45 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.30 (1H, br)

No. 52

構造



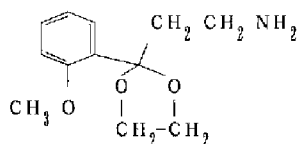
形状 無色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.09 (3H, s), 2.44 (3H, s), 3.50 (2H, d, $J=6\text{Hz}$), 5.82 (1H, t, $J=6\text{Hz}$), 6.34 (1H, s), 7.25 (1H, dd, $J=8\text{Hz}$, 2Hz), 7.32 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.46 (1H, d, $J=2\text{Hz}$)

No. 53

構造



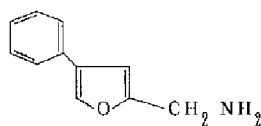
形状 無色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.31 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 2.72 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 3.82-3.91 (2H, m), 3.88 (3H, s), 3.98-4.07 (2H, m), 6.90 (1H, t, $J=8\text{Hz}$), 6.93 (1H, t, $J=8\text{Hz}$), 7.29 (1H, t, $J=8\text{Hz}$), 7.47 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)

No. 54

構造



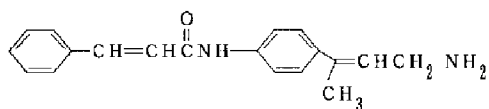
形状 淡黄色針状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

3.86 (2H, s), 6.47 (1H, s), 7.20-7.55 (5H, m), 7.64 (1H, s)

No. 55

構造



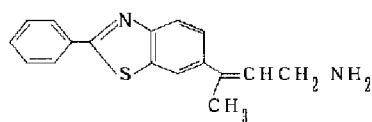
形状 淡黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.03 (3H, s), 3.49 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 5.84 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 6.59 (1H, d, $J=16\text{Hz}$), 7.35-7.68 (10H, m), 7.75 (1H, d, $J=16\text{Hz}$)

No. 56

構造



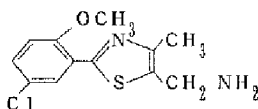
形状 黄色固体

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.14 (3H, s), 3.54 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 5.96 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 7.45-7.60 (4H, m), 7.91 (1H, d, $J=2\text{Hz}$), 8.00 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 8.07-8.11 (2H, m)

No. 57

構造



形状 淡黄色粉末状

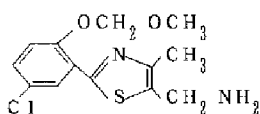
 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.43 (3H, s), 3.99 (3H, s), 4.05 (2H, s), 6.93 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.28 (1H, dd, $J=8\text{Hz}, 3\text{Hz}$), 8.32 (1H, d, $J=3\text{Hz}$)

No. 58	構造	
形状	黄色不定形	
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :	2. 14 (3H, s), 3. 54 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 4. 06 (3H, s), 5. 96 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 7. 00 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 39 (1H, dd, $J=8\text{Hz}$, 3Hz), 7. 57 (1H, dd, $J=8\text{Hz}$, 2Hz), 7. 92 (1H, d, $J=2\text{Hz}$), 8. 01 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 8. 53 (1H, d, $J=3\text{Hz}$)	
No. 59	構造	
形状	褐色油状	
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :	3. 97 (2H, s), 6. 52 (1H, d, $J=2\text{Hz}$), 7. 25-7. 55 (6H, m)	
No. 60	構造	
形状	黄色不定形	
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :	2. 06 (3H, s), 2. 65 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 2. 98 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 3. 53 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 5. 94 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 6. 72 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 23 (2H, m), 8. 06 (1H, br)	

No. 61

構造



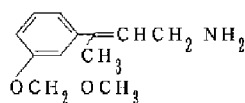
形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.44 (3H, s), 3.52 (3H, s), 4.06 (2H, s),
5.35 (2H, s), 7.17 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.26
(1H, dd, $J=8\text{Hz}$, 2Hz), 8.34 (1H, d, $J=$
 2Hz)

No. 62

構造



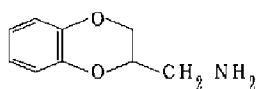
形状 無色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.04 (3H, s), 3.48 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 3.49
(3H, s), 5.19 (2H, s), 5.86 (1H, t,
 $J=7\text{Hz}$), 6.93 (1H, dd, $J=8\text{Hz}$, 3Hz), 7.05
(1H, dd, $J=8\text{Hz}$, 3Hz), 6.95 (1H, s), 7.23
(1H, t, $J=8\text{Hz}$)

No. 63

構造



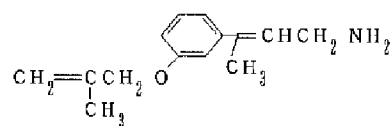
形状 無色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.98 (2H, dd, $J=6\text{Hz}$, 2Hz), 4.01 (1H, dd,
 $J=11\text{Hz}$, 7Hz), 4.13 (1H, m), 4.27 (1H, dd,
 $J=11\text{Hz}$, 2Hz), 6.81-6.92 (4H, m)

No. 65

構造



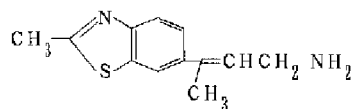
形状 無色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 84 (3H, s), 2. 04 (3H, s), 3. 49 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 4. 44 (2H, s), 4. 99 (1H, s), 5. 10 (1H, s), 6. 82 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 6. 97 (1H, s), 6. 99 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 5. 86 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 7. 22 (1H, t, $J=8\text{Hz}$)

No. 66

構造



形状 無色不定形

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

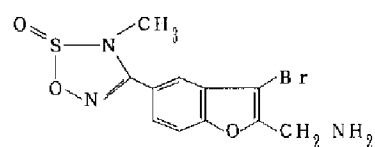
2. 11 (3H, s), 2. 83 (3H, s), 3. 52 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 5. 91 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 7. 50 (1H, dd, $J=8\text{Hz}$, 2Hz), 7. 82 (1H, d, $J=2\text{Hz}$), 7. 87 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)

【0855】

【表44】

No. 67

構造



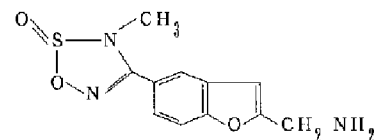
形状 淡黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :

3.41 (3H, s), 3.96 (2H, s), 7.06 (1H, d, $J=2\text{Hz}$), 7.14 (1H, dd, $J=8\text{Hz}$, 2Hz), 7.43 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)

No. 68

構造



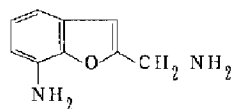
形状 淡黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :

3.35 (3H, s), 3.97 (2H, s), 6.68 (1H, s), 7.03 (1H, dd, $J=8\text{Hz}$, 2Hz), 7.17 (1H, d, $J=2\text{Hz}$), 7.41 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)

No. 69

構造



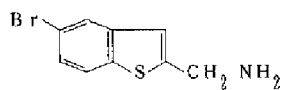
形状 黄色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :

1.59 (2H, brs), 3.92 (2H, brs), 3.96 (2H, s), 6.48 (1H, s), 6.61 (1H, d, $J=7\text{Hz}$), 6.9-7.1 (2H, m)

No. 70

構造



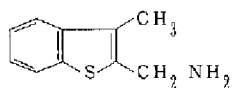
形状 黄色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 61 (2H, brs), 4. 14 (2H, s), 7. 06 (1H, s), 7. 37 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 64 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 82 (1H, s)

No. 71

構造



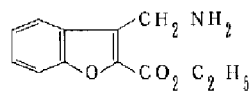
形状 黄色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 51 (2H, brs), 2. 34 (3H, s), 4. 09 (2H, s), 7. 2-7. 4 (2H, m), 7. 63 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 79 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)

No. 72

構造



形状 黄色油状

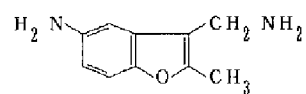
 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 46 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1. 68 (2H, brs), 4. 25 (2H, s), 4. 48 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 7. 3-7. 5 (2H, m), 7. 58 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 77 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)

No. 73	
構造	
形状	淡黄色油状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	1. 46 (2H, brs), 2. 44 (3H, s), 3. 91 (2H, s), 7. 1-7. 3 (2H, m), 7. 3-7. 4 (1H, m), 7. 5-7. 6 (1H, m)
No. 74	
構造	
形状	黄色粉末状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	1. 53 (2H, brs), 3. 87 (2H, brs), 3. 95 (2H, s), 6. 45 (1H, s), 6. 49 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 6. 90 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 05 (1H, dd, $J=8\text{Hz}$, 8Hz)
No. 75	
構造	
形状	黄色粉末状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	1. 54 (2H, brs), 3. 71 (2H, brs), 3. 90 (2H, s), 6. 38 (1H, s), 6. 60 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 6. 77 (1H, s), 7. 26 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)

No. 76

構造



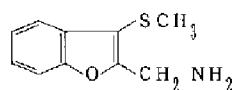
形状 棕色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.44 (2H, brs), 2.38 (3H, s), 3.56 (2H, brs), 3.83 (2H, s), 6.59 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 6.83 (1H, s), 7.17 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)

No. 77

構造



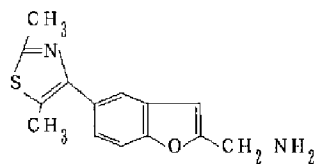
形状 棕色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.57 (2H, brs), 2.35 (3H, s), 4.10 (2H, s), 7.2-7.3 (2H, m), 7.4-7.5 (1H, m), 7.6-7.7 (1H, m)

No. 78

構造



形状 白色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

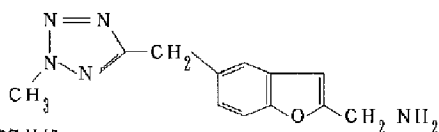
1.64 (2H, brs), 2.52 (3H, s), 2.69 (3H, s), 3.99 (2H, s), 6.55 (1H, s), 7.4-7.6 (2H, m), 7.74 (1H, s)

No. 79	
構造	
形状	橙色粉末状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :	1. 59 (2H, brs), 4. 00 (2H, s), 6. 60 (1H, s), 7. 3-7. 5 (5H, m), 7. 9-8. 1 (3H, m), 8. 22 (1H, s)
No. 80	
構造	
形状	白色粉末状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :	1. 61 (2H, brs), 2. 61 (3H, s), 4. 00 (2H, s), 6. 58 (1H, s), 7. 3-7. 6 (4H, m), 7. 61 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 85 (1H, s), 7. 9-8. 0 (2H, m)
No. 81	
構造	
形状	褐色粉末状
$^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm :	3. 0-3. 1 (1H, m), 3. 4-3. 6 (1H, m), 4. 09 (2H, s), 4. 7-4. 8 (1H, m), 6. 85 (1H, s), 7. 18 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7. 4-7. 6 (2H, m)

No. 82	
構造	
形状	黄色油状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	1. 58 (2H, brs), 2. 79 (3H, s), 3. 99 (2H, s), 6. 56 (1H, s), 7. 26 (1H, s), 7. 45 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 75 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 8. 06 (1H, s)
No. 83	
構造	
形状	褐色粉末状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	1. 53 (2H, brs), 4. 00 (2H, s), 6. 59 (1H, s), 7. 30 (1H, d, $J=3\text{Hz}$), 7. 48 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7. 8-7. 9 (2H, m), 8. 14 (1H, s)
No. 84	
構造	
形状	黄色油状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	1. 56 (2H, brs), 2. 52 (3H, s), 2. 70 (3H, s), 4. 03 (2H, s), 7. 4-7. 6 (3H, m), 7. 85 (1H, s)

No. 85

構造



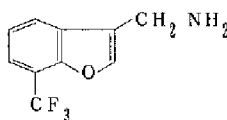
形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 57 (2H, brs), 3. 95 (2H, s), 4. 29 (3H, s), 4. 30 (2H, s), 6. 47 (1H, s), 7. 21 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 36 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 46 (1H, s)

No. 86

構造



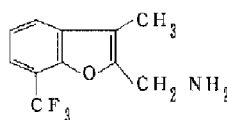
形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 49 (2H, brs), 4. 05 (2H, s), 7. 33 (1H, dd, $J=8\text{Hz}$, 8Hz), 7. 56 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 66 (1H, s), 7. 81 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)

No. 87

構造



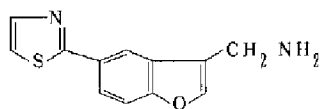
形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 61 (2H, brs), 2. 24 (3H, s), 3. 97 (2H, s), 7. 28 (1H, dd, $J=8\text{Hz}$, 8Hz), 7. 49 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 63 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)

No. 88

構造



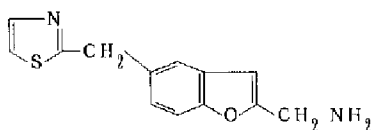
形状 黄色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.45 (2H, brs), 4.06 (2H, s), 7.32 (1H, d, $J=3\text{Hz}$), 7.52 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.60 (1H, s), 7.8-8.0 (2H, m), 8.24 (1H, s)

No. 89

構造



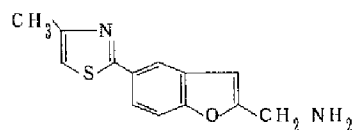
形状 黄色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.57 (2H, brs), 3.96 (2H, s), 4.42 (2H, s), 6.49 (1H, s), 7.1-7.3 (2H, m), 7.49 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.46 (1H, s), 7.70 (1H, d, $J=3\text{Hz}$)

No. 90

構造



形状 黄色粉末状

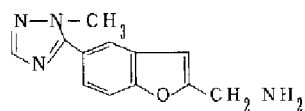
 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.54 (2H, brs), 2.51 (3H, s), 3.99 (2H, s), 6.57 (1H, s), 6.84 (1H, s), 7.45 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.83 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 8.11 (1H, s)

No. 91	
構造	
形状	黄色油状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	1. 53 (2H, brs), 4. 05 (2H, s), 7. 52 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 6-7. 8 (3H, m)
No. 92	
構造	
形状	黄色粉末状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	1. 56 (2H, brs), 2. 24 (3H, s), 3. 97 (2H, s), 7. 4-7. 6 (2H, m), 7. 67 (1H, s)
No. 93	
構造	
形状	黄色粉末状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	1. 54 (2H, brs), 3. 97 (3H, s), 3. 98 (2H, s), 6. 58 (1H, s), 7. 48 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 8. 01 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 8. 05 (1H, s), 8. 26 (1H, s)

No. 94

構造



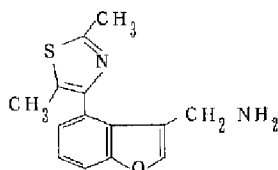
形状 黄色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 61 (2H, brs), 4. 01 (3H, s), 4. 02 (2H, s), 6. 62 (1H, s), 7. 5-7. 6 (2H, m), 7. 83 (1H, s), 7. 95 (1H, s)

No. 95

構造



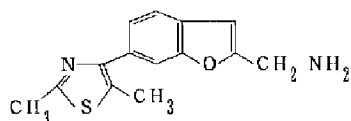
形状 褐色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 37 (2H, brs), 2. 34 (3H, s), 2. 71 (3H, s), 3. 54 (2H, s), 7. 15 (1H, d, $J=7\text{Hz}$), 7. 33 (1H, dd, $J=7\text{Hz}$, 8Hz), 7. 50 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 55 (1H, s)

No. 96

構造



形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

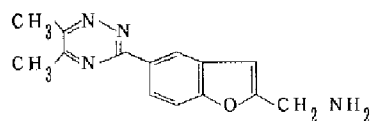
1. 54 (2H, brs), 2. 54 (3H, s), 2. 69 (3H, s), 3. 99 (2H, s), 6. 54 (1H, s), 7. 4-7. 6 (2H, m), 7. 67 (1H, s)

【0865】

【表54】

No. 97

構造



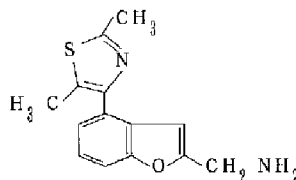
形状 淡黄色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 54 (2H, brs), 2. 61 (3H, s), 2. 72 (3H, s), 4. 01 (2H, s), 6. 63 (1H, s), 7. 54 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 8. 46 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 8. 70 (1H, s)

No. 98

構造



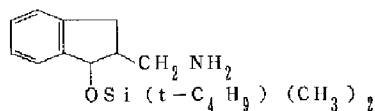
形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 49 (2H, brs), 2. 47 (3H, s), 2. 71 (3H, s), 3. 97 (2H, s), 6. 69 (1H, s), 7. 2-7. 5 (3H, m)

No. 99

構造



形状 黄色油状

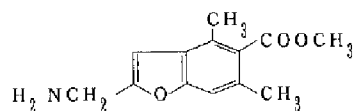
 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

0. 16 (3H, s), 0. 20 (3H, s), 0. 95 (9H, s), 1. 61 (2H, brs), 2. 3-2. 4 (1H, m), 2. 5-2. 6 (1H, m), 2. 7-2. 9 (1H, m), 3. 0-3. 2 (2H, m), 4. 94 (1H, d, $J=7\text{Hz}$), 7. 1-7. 3 (4H, m)

No. 100
構造
形状 黄色油状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm : 1. 50 (2H, brs), 2. 54 (3H, s), 2. 70 (3H, s), 4. 04 (2H, s), 7. 5-7. 7 (3H, m), 7. 73 (1H, s)
No. 101
構造
形状 白色粉末状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm : 2. 17 (3H, s), 3. 88 (2H, d, $J=6.8\text{Hz}$), 6. 51 (1H, t, $J=6.8\text{Hz}$), 6. 63 (1H, s), 7. 20 (1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7. 33 (1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7. 49 (1H, s)
No. 102
構造
形状 黄色油状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm : 2. 97 (3H, s), 4. 00 (2H, brs), 6. 27 (1H, brs), 7. 42 (1H, brd, $J=8\text{Hz}$), 7. 65 (1H, brs), 7. 76 (1H, brd, $J=8\text{Hz}$), 8. 05 (1H, brs)

No. 103

構造

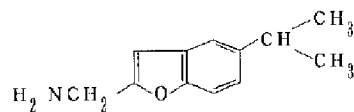


形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:2.39 (3H, s), 2.42 (3H, s), 3.92 (3H, s),
4.05 (2H, s), 6.65 (1H, s), 7.12 (1H, s)

No. 104

構造

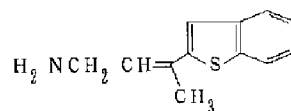


形状 淡黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:1.27 (6H, d, $J=6.9\text{Hz}$), 2.99 (1H, sept, $J=6.9\text{Hz}$), 3.99 (2H, s), 6.52 (1H, s),
7.12 (1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.34 (1H, d, $J=8.7\text{Hz}$), 7.36 (1H, s)

No. 105

構造

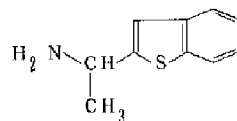


形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:2.13 (3H, brs), 3.53 (2H, d, $J=6.6\text{Hz}$),
6.10 (1H, t, $J=6.6\text{Hz}$), 7.19 (1H, s), 7.2-7.4 (2H, m), 7.6-7.8 (2H, m)

No. 106

構造



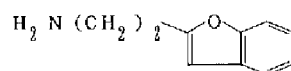
形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.55 (3H, d, $J=7.4\text{Hz}$), 4.44 (1H, q, $J=7.4\text{Hz}$), 7.13 (1H, s), 7.2-7.4 (2H, m), 7.68 (1H, d, $J=7.3\text{Hz}$), 7.80 (1H, d, $J=7.3\text{Hz}$)

No. 107

構造



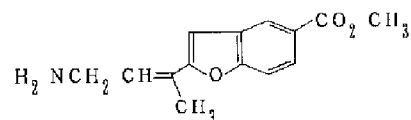
形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.92 (2H, t, $J=6.5\text{Hz}$), 3.10 (2H, t, $J=6.5\text{Hz}$), 6.46 (1H, s), 7.1-7.3 (2H, m), 7.4-7.6 (2H, m)

No. 108

構造



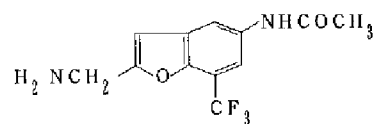
形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.19 (3H, s), 3.91 (2H, d, $J=6.5\text{Hz}$), 3.94 (3H, s), 6.54 (1H, t, $J=6.5\text{Hz}$), 6.74 (1H, s), 7.43 (1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 8.00 (1H, d, $J=8.6\text{Hz}$), 8.27 (1H, s)

No. 109

構造

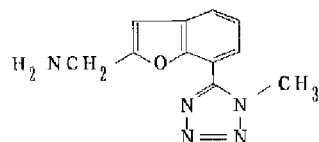


形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:2. 21 (3H, s), 4. 01 (2H, s), 6. 59 (1H, s),
7. 42 (1H, s), 8. 06 (1H, s)

No. 110

構造

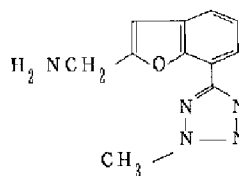


形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:4. 02 (2H, s), 4. 15 (3H, s), 6. 69 (1H, s),
7. 40 (1H, t, $J=8.1\text{Hz}$), 7. 58 (1H, d, $J=$
8. 1Hz), 7. 76 (1H, d, $J=8.1\text{Hz}$)

No. 111

構造

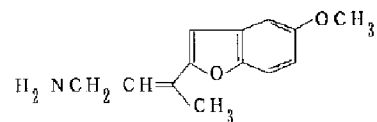


形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:4. 10 (2H, s), 4. 49 (3H, s), 6. 64 (1H, s),
7. 34 (1H, t, $J=7.7\text{Hz}$), 7. 65 (1H, d,
 $J=7.7\text{Hz}$), 8. 05 (1H, d, $J=7.7\text{Hz}$)

No. 112

構造



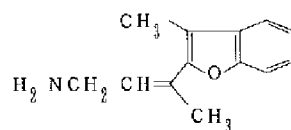
形状 淡黄色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.02 (3H, brs), 3.54 (2H, d, $J=6.8\text{Hz}$),
 3.84 (3H, s), 6.41 (1H, t, $J=6.8\text{Hz}$),
 6.54 (1H, s), 6.84 (1H, dd, $J=8.8\text{Hz}$,
 2.5Hz), 6.98 (1H, d, $J=2.5\text{Hz}$), 7.30 (1H,
 d, $J=8.8\text{Hz}$)

No. 113

構造



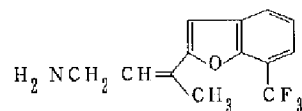
形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.12 (3H, brs), 2.35 (3H, s), 3.55 (2H, d,
 $J=6.7\text{Hz}$), 6.11 (1H, t, $J=6.7\text{Hz}$), 7.2-
 7.3 (2H, m), 7.4-7.5 (2H, m)

No. 114

構造



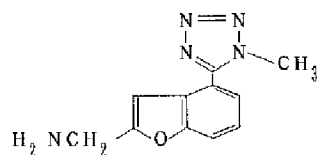
形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.05 (3H, brs), 3.56 (2H, d, $J=7.1\text{Hz}$),
 6.53 (1H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 6.64 (1H, s),
 7.25 (1H, t, $J=6.9\text{Hz}$), 7.48 (1H, d, $J=$
 6.9Hz), 7.68 (1H, d, $J=6.9\text{Hz}$)

No. 115

構造



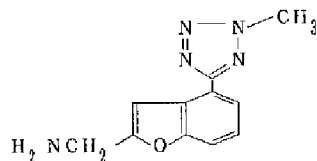
形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

4.03 (2H, s), 4.20 (3H, s), 6.69 (1H, s),
7.4-7.5 (2H, m), 7.6-7.7 (1H, m)

No. 116

構造



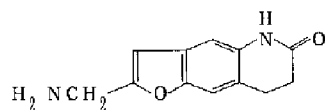
形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

4.05 (2H, s), 4.45 (3H, s), 7.33 (1H, s),
7.37 (1H, t, $J=7.6\text{ Hz}$), 7.55 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$), 8.06 (1H, d, $J=7.6\text{ Hz}$)

No. 117

構造



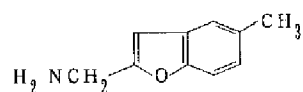
形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.44 (2H, t, $J=7.5\text{ Hz}$), 2.96 (2H, t, $J=7.5\text{ Hz}$), 4.00 (2H, s), 6.68 (1H, s), 7.00 (1H, s), 7.37 (1H, s), 10.11 (1H, s)

No. 118

構造

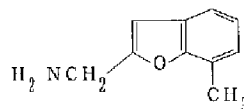


形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:2.42 (3H, s), 3.95 (2H, s), 6.45 (1H, s),
7.0-7.2 (1H, m), 7.3-7.5 (2H, m)

No. 119

構造

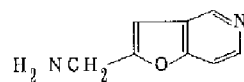


形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:2.51 (3H, s), 3.98 (2H, s), 6.51 (1H, s),
7.06 (1H, d, $J=7.3\text{ Hz}$), 7.10 (1H, t, $J=$
7.3 Hz), 7.34 (1H, d, $J=7.3\text{ Hz}$)

No. 120

構造

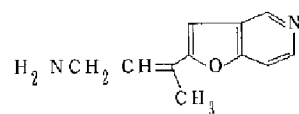


形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:4.02 (2H, s), 6.61 (1H, s), 7.39 (1H, d,
 $J=5.7\text{ Hz}$), 8.46 (1H, d, $J=5.7\text{ Hz}$), 8.86
(1H, s)

No. 121

構造



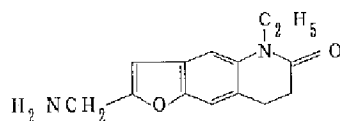
形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.05 (3H, s), 3.56 (2H, d, $J=6.6\text{Hz}$),
 6.50 (1H, t, $J=6.6\text{Hz}$), 6.64 (1H, s),
 7.37 (1H, d, $J=5.7\text{Hz}$), 8.45 (1H, d,
 $J=5.7\text{Hz}$), 8.84 (1H, s)

No. 122

構造



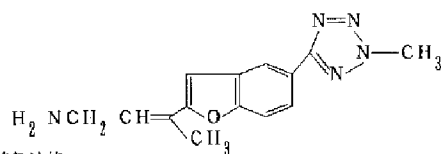
形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1.29 (3H, t, $J=7.1\text{Hz}$), 2.64 (2H, t, $J=$
 8.2Hz), 2.97 (2H, t, $J=8.2\text{Hz}$), 4.04 (2H,
 q, $J=7.1\text{Hz}$), 4.12 (2H, s), 6.71 (1H, s),
 7.16 (1H, s), 7.27 (1H, s)

No. 123

構造



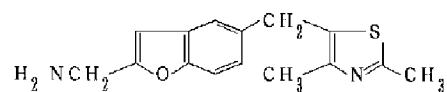
形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.21 (3H, s), 3.91 (2H, d, $J=6.6\text{Hz}$),
 4.41 (3H, s), 6.54 (1H, t, $J=6.6\text{Hz}$),
 6.76 (1H, s), 7.52 (1H, d, $J=8.5\text{Hz}$),
 8.06 (1H, d, $J=8.5\text{Hz}$), 8.33 (1H, s)

No. 124

構造



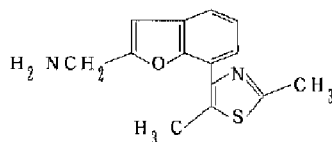
形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.39 (3H, s), 2.61 (3H, s), 3.98 (2H, s),
4.12 (2H, s), 6.47 (1H, s), 7.07 (1H, d,
 $J=8.4\text{ Hz}$), 7.30 (1H, s), 7.47 (1H, d, $J=$
8.4 Hz)

No. 125

構造



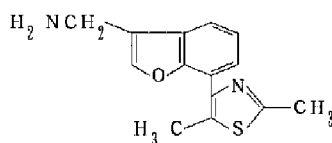
形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.41 (3H, s), 2.72 (3H, s), 3.97 (2H, s),
6.58 (1H, s), 7.3-7.7 (3H, m)

No. 126

構造



形状 黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

2.41 (3H, s), 2.72 (3H, s), 4.04 (2H, s),
7.3-7.7 (4H, m)

【0875】適当な出発原料を用い、前記参考例15～
21と同様にして下記表64～表65に示すNo. 1～
No. 7の化合物を得た。

【0876】
【表64】

No. 1	構造	
形状	黄色粉末状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm : 1. 47 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 2. 51 (3H, s), 2. 53 (3H, s), 2. 57 (3H, s), 4. 58 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 8. 31 (1H, s), 8. 36 (1H, s)
No. 2	構造	
形状	橙色粉末状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm : 1. 49 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 2. 48 (3H, s), 2. 50 (3H, s), 2. 93 (3H, s), 4. 55 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 7. 78 (1H, s), 7. 91 (1H, s)
No. 3	構造	
形状	淡黄色粉末状	$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm : 1. 48 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 2. 48 (3H, s), 2. 53 (3H, s), 2. 80 (3H, s), 4. 54 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 7. 93 (1H, s), 8. 34 (1H, s)

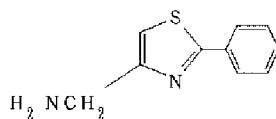
No. 4	
構造	
mp	83-95℃
形状	無色針状 (ジクロロメタン-n-ヘキサンより再結晶)
¹ H-NMR (CDCl ₃) δ ppm:	1. 53 (3H, t, J=7Hz), 4. 61 (2H, q, J=7Hz), 5. 14 (2H, s), 7. 81-7. 93 (2H, m), 8. 11 (1H, m), 8. 23 (1H, m)
No. 5	
構造	
mp	96-97℃
形状	白色粉末状 (ジクロロメタン-n-ヘキサンより再結晶)
No. 6	
構造	
mp	109-110℃
形状	無色鱗片状 (ジクロロメタン-n-ヘキサンより再結晶)
No. 7	
構造	
mp	140-141℃
形状	褐色粉末状 (クロロホルムより再結晶)

【0878】適当な出発原料を用い、前記参考例3、
 9、11及び14と同様にして、下記No. 1~26の化
 合物を得た。

【0879】
 【表66】

No. 1

構造



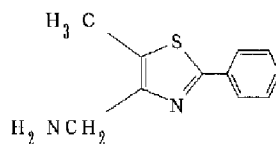
形状 淡黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

7. 9-8. 0 (2H, m), 7. 4-7. 5 (3H, m), 7. 08 (1H, s), 4. 05 (2H, s)

No. 2

構造



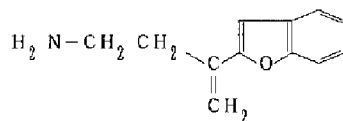
形状 淡黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

7. 85-7. 95 (2H, m), 7. 4-7. 5 (3H, m), 3. 88 (2H, s), 2. 45 (3H, s)

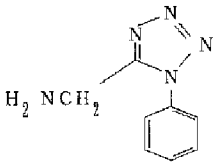
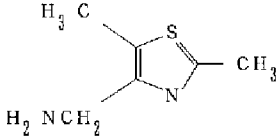
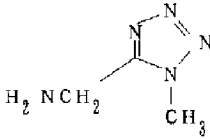
No. 3

構造



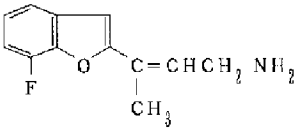
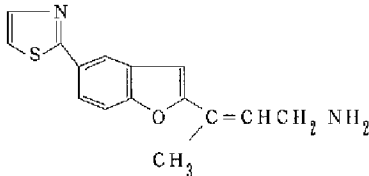
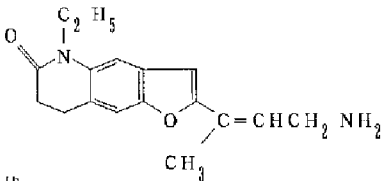
形状 黄色油状

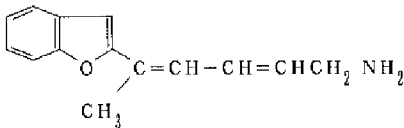
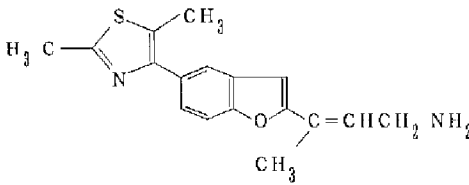
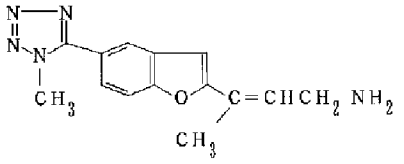
 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:7. 5-7. 6 (1H, m), 7. 4-7. 5 (1H, m), 7. 2-7. 3 (2H, m), 6. 69 (1H, s), 5. 90 (1H, s), 5. 23 (1H, s), 2. 98 (2H, t, $J=6.0\text{ Hz}$), 2. 62 (2H, t, $J=6.0\text{ Hz}$)

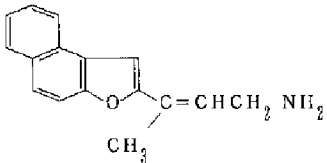
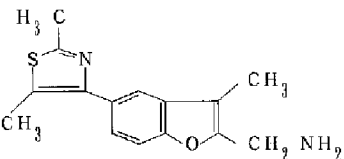
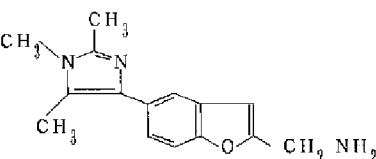
No. 4	
構造	
形状	淡黄色油状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	7. 58 (5H, brs), 4. 17 (2H, s)
No. 5	
構造	
形状	淡黄色油状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	3. 88 (2H, s), 2. 59 (3H, s), 2. 53 (3H, s)
No. 6	
構造	
形状	淡黄色油状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	4. 16 (2H, s), 4. 23 (3H, s)

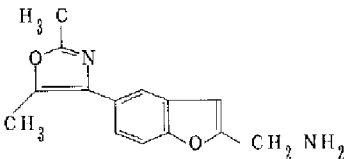
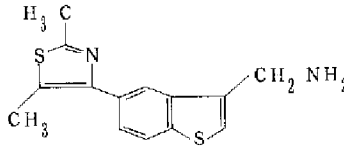
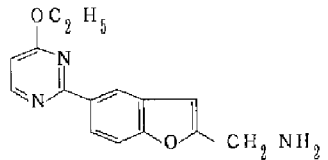
【0881】

【表68】

No. 7	
構造	
形状	淡黄色油状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :	1. 23 (2H, br), 2. 04 (3H, s), 3. 55 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 6. 51 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 6. 62 (1H, d, $J=3\text{Hz}$), 6. 90-7. 15 (2H, m), 7. 40-7. 60 (2H, m)
No. 8	
構造	
形状	白色固体
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :	1. 41 (2H, br), 2. 04 (3H, s), 3. 56 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 6. 46 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 6. 64 (1H, s), 7. 30 (1H, d, $J=3\text{Hz}$), 7. 46 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7. 85 (1H, d, $J=2\text{Hz}$), 7. 86 (1H, dd, $J=9\text{Hz}$, 3Hz), 8. 13 (1H, d, $J=2\text{Hz}$)
No. 9	
構造	
形状	淡黄色油状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :	1. 30 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1. 56 (2H, br), 2. 02 (3H, s), 2. 64 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 2. 96 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 3. 54 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 4. 04 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 6. 41 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 6. 56 (1H, s), 7. 12 (1H, s), 7. 21 (1H, s)

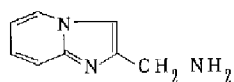
No. 10 構造	
形状	黄色粉末状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	2.13 (3H, s), 3.47 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 6.05 (1H, dt, $J=15\text{Hz}$, 7Hz), 6.57 (1H, dd, $J=15\text{Hz}$, 12Hz), 6.65 (1H, s), 6.97 (1H, d, $J=12\text{Hz}$), 7.15-7.42 (2H, m), 7.43 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.51 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)
No. 11 構造	
形状	淡黄色粉末状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	2.05 (3H, s), 2.52 (3H, s), 2.69 (3H, s), 3.56 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 6.46 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 6.62 (1H, s), 7.45 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.51 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.73 (1H, s)
No. 12 構造	
形状	黄色粉末状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	2.07 (3H, s), 3.58 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 4.20 (3H, s), 6.52 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 6.68 (1H, s), 7.59 (2H, s), 7.89 (1H, s)

No. 13	
構造	
形状 淡黄色粉末状	
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	
	2. 11 (3H, s), 3. 57 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 6. 47 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 7. 10 (1H, s), 7. 43-7. 62 (3H, m), 7. 69 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 93 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 8. 11 (1H, d, $J=8\text{Hz}$)
No. 14	
構造	
形状 黄色油状	
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	
	1. 78 (2H, brs), 2. 23 (3H, s), 2. 52 (3H, s), 2. 70 (3H, s), 3. 96 (2H, s), 7. 4-7. 5 (2H, m), 7. 70 (1H, s)
No. 15	
構造	
形状 黄色粉末状	
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	
	1. 53 (2H, brs), 2. 37 (3H, s), 2. 43 (3H, s), 3. 48 (3H, s), 3. 97 (2H, s), 6. 52 (1H, s), 7. 4-7. 6 (2H, m), 7. 72 (1H, s)

No. 16	
構造	
形状	黄色油状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	1. 56 (2H, brs), 2. 47 (3H, s), 2. 51 (3H, s), 3. 98 (2H, s), 6. 54 (1H, s), 7. 4-7. 6 (2H, m), 7. 77 (1H, s)
No. 17	
構造	
形状	無色油状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	1. 56 (2H, brs), 2. 54 (3H, s), 2. 71 (3H, s), 4. 17 (2H, s), 7. 33 (1H, s), 7. 61 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 90 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 8. 01 (1H, s)
No. 18	
構造	
形状	白色粉末状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	1. 46 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1. 57 (2H, brs), 3. 98 (2H, s), 4. 57 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 6. 57 (1H, d, $J=6\text{Hz}$), 6. 59 (1H, s), 7. 49 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 8. 38 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 8. 48 (1H, d, $J=6\text{Hz}$), 8. 61 (1H, s)

No. 19

構造



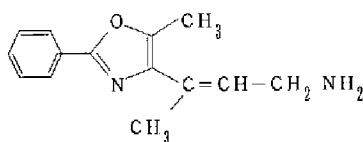
形状 褐色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 62 (2H, brs), 4. 03 (2H, s), 6. 75 (1H, dd, $J=7\text{Hz}$, 7Hz), 7. 15 (1H, dd, $J=7\text{Hz}$, 8Hz), 7. 48 (1H, s), 7. 54 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 8. 07 (1H, d, $J=7\text{Hz}$)

No. 20

構造



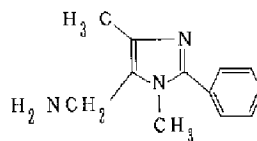
形状 淡黄色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 29 (2H, brs), 2. 06 (3H, s), 2. 50 (3H, s), 3. 50 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 6. 05 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 7. 4-7. 5 (3H, m), 7. 9-8. 1 (2H, m)

No. 21

構造



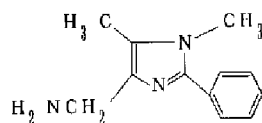
形状 無色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 2-1. 5 (2H, br), 2. 27 (3H, s), 3. 71 (3H, s), 3. 88 (2H, s), 7. 3-7. 7 (5H, m)

No. 22

構造



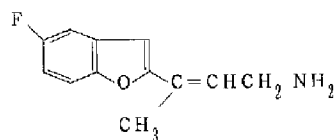
形状 淡黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 55 (2H, brs), 2. 26 (3H, s), 3. 56 (3H, s), 3. 78 (2H, s), 7. 3-7. 6 (5H, m)

No. 23

構造

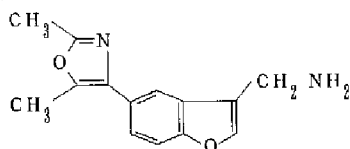


形状 淡黄色粉末状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:1. 25 (2H, brs), 2. 01 (3H, s), 3. 54 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 6. 43 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 6. 55 (1H, s), 6. 9-7. 0 (1H, m), 7. 15 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7. 2-7. 4 (1H, m)

No. 24

構造



形状 淡黄色油状

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 65 (2H, brs), 2. 48 (3H, s), 2. 51 (3H, s), 4. 03 (2H, s), 7. 4-7. 6 (3H, m), 7. 87 (1H, s)

No. 25	
構造	
形状	淡黄色粉末状
$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ ppm :	1. 96 (3H, s), 2. 04 (3H, s), 3. 36 (2H, d, $J=7\text{ Hz}$), 6. 31 (1H, t, $J=7\text{ Hz}$), 6. 82 (1H, s), 7. 31 (1H, dd, $J=2\text{ Hz}$, 9 Hz), 7. 42 (1H, d, $J=9\text{ Hz}$), 7. 90 (1H, d, $J=2\text{ Hz}$), 9. 91 (1H, s)
No. 26	
構造	
形状	黄色粉末状
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl $_3$) δ ppm :	1. 31 (2H, brs), 2. 02 (3H, s), 3. 55 (2H, d, $J=7\text{ Hz}$), 6. 51 (1H, t, $J=7\text{ Hz}$), 6. 58 (1H, d, $J=3\text{ Hz}$), 6. 77 (1H, dd, $J=10\text{ Hz}$, 10 Hz), 6. 97 (1H, d, $J=8\text{ Hz}$)

【0888】適当な出発原料を用い、前記参考例15～21と同様にして、下記No. 1～6の化合物を得た。

【0889】
【表75】

No. 1	
構造	
形状 黄色粉末状	
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :	<p>1. 48 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 2. 56 (3H, s), 4. 00 (3H, s), 4. 59 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 7. 46 (1H, dd, $J=3\text{Hz}, 10\text{Hz}$), 7. 86 (1H, d, $J=3\text{Hz}$), 8. 51 (1H, d, $J=10\text{Hz}$)</p>
No. 2	
構造	
形状 黄色粉末状	
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :	<p>1. 49 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 2. 78 (3H, s), 3. 96 (3H, s), 4. 56 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 7. 3-7. 5 (2H, m), 8. 48 (1H, d, $J=9\text{Hz}$)</p>
No. 3	
構造	
形状 褐色粉末状	
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm :	<p>1. 26 (6H, t, $J=7\text{Hz}$), 1. 47 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 2. 52 (3H, s), 3. 52 (4H, q, $J=7\text{Hz}$), 4. 57 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 7. 27 (1H, dd, $J=3\text{Hz}, 10\text{Hz}$), 7. 42 (1H, d, $J=3\text{Hz}$), 8. 39 (1H, d, $J=10\text{Hz}$)</p>

No. 4	
構造	
形状 褐色粉末状	
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	<p>1. 25 (6H, t, $J=7\text{Hz}$), 1. 47 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 2. 73 (3H, s), 3. 50 (4H, q, $J=7\text{Hz}$), 4. 53 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 7. 08 (1H, d, $J=3\text{Hz}$), 7. 29 (1H, dd, $J=3\text{Hz}$, 10Hz), 8. 38 (1H, d, $J=10\text{Hz}$)</p>
No. 5	
構造	
形状 褐色粉末状	
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	<p>1. 0-1. 4 (6H, br), 1. 48 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 2. 60 (3H, s), 3. 1-3. 7 (4H, br), 4. 59 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 7. 8-7. 9 (1H, m), 8. 5-8. 6 (2H, m)</p>
No. 6	
構造	
形状 褐色粉末状	
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:	<p>1. 0-1. 4 (6H, br), 1. 49 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 2. 81 (3H, s), 3. 2-3. 8 (4H, br), 4. 56 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 7. 80 (1H, dd, $J=2\text{Hz}$, 9Hz), 8. 24 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 8. 58 (1H, d, $J=2\text{Hz}$)</p>

【0891】実施例1

窒素雰囲気下2-エトキシカルボニル-3-メチルキノキサリン-4-オキシド1.5g及び3-アミノメチルベンゾフラン1.9gを混合し、60℃で一夜攪拌した。反応物をシリカゲルクロマトグラフィー（溶出溶媒；n-ヘキサン：酢酸エチル=3：1）で精製し、エタノールより再結晶し、無色針状品として1.3gの2-〔（3-ベンゾフランニル）メチルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシドを得た。m. p. 143~144℃。

【0892】実施例2

2-カルボキシ-3-メチルキノキサリン-4-オキシド0.8g及び2-アミノメチル-5-ジメチルアミノベンゾフラン0.9gをジメチルホルムアミド10mlに溶解し、氷冷下シアノリン酸ジエチル0.8g、次にトリエチルアミン0.8gを順次滴下した。室温で一夜攪拌後、酢酸エチルで抽出し、水洗後無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロ

マトグラフィー（溶出溶媒；n-ヘキサン：酢酸エチル=1：1）で精製し、アセトニトリルより再結晶し、黄色板状品として0.6gの2-〔（5-ジメチルアミノ-2-ベンゾフランニル）メチルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシドを得た。m. p. 155~157℃。

【0893】実施例3

2-キノキサリンカルボン酸0.5gをジクロロメタン10mlに溶解し、ジシクロヘキシルカルボジイミド0.7gを加え、30分攪拌後、2-アミノメチルベンゾフラン0.5gを加えて一夜攪拌した。不溶物を濾去し、有機層を飽和重曹水、水で洗浄し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（溶出溶媒；n-ヘキサン：酢酸エチル=3：1）で精製し、n-ヘキサン-酢酸エチルより再結晶し、無色リン片状品として0.43gの2-〔（2-ベンゾフランニル）メチルアミノカルボニル〕キノキサリンを得た。m. p. 155~156℃。

【0894】実施例4

2-〔(4-モルホリノカルボニルメトキシベンジル)アミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン2.2gを塩化メチレン30mlに溶解し、室温下m-クロロ過安息香酸1.3gを加え一日撹拌した。クロロホルムを加え、有機層をチオ硫酸ナトリウム水溶液、飽和重曹水、水の順で洗浄し無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:酢酸エチル)で精製後、アセトニトリルより再結晶し、無色針状晶として1.5gの2-〔(4-モルホリノカルボニルメトキシベンジル)アミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシドを得た。m. p. 142~143℃。

【0895】適当な出発原料を用い、実施例4と同様にして下記実施例28~103、125、126、128、130~135、137、138、141、143~146、148、150、152、154~157、159、161、163、165、167、169、171、173、175、177~184、187~189、191、192、194、196~201、203~205、207、209~213、216、219、220、224、226、228~230、233、235、236、239及び240並びに後記実施例435~440、442~479及び484~487の化合物を得た。

【0896】実施例5

2-シンナミルアミノカルボニル-3-メチルキノキサリン1.0gをジメチルホルムアミド15mlに溶解し氷冷水素化ナトリウム160mgを加えた。同温度で30分撹拌後、沃化メチル0.52gを加え、室温にて2時間撹拌した。氷水にあげジエチルエーテルで抽出し、水洗後、無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:n-ヘキサン:酢酸エチル=2:1)にて精製し、淡黄色液体として0.8gの2-(N-シンナミル-N-メチルアミノカルボニル)-3-メチルキノキサリンを得た。

【0897】 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 2.78, 2.79 (3H, s)、2.92, 3.24 (3H, s)、3.98, 4.43 (2H, d, $J=6$ Hz)、6.10-6.40 (1H, m)、6.40, 6.70 (1H, d, $J=16$ Hz)、7.20-7.50 (5H, m)、7.70-7.85 (2H, m)、8.00-8.15 (2H, m)。

【0898】適当な出発原料を用い、実施例5と同様にして下記実施例44、66、107、110、135、138、150、151、152、153、175、176、178、186、187、191及び192の化合物を得た。

【0899】実施例6

2-〔(5-アミノベンゾフラン-2-イル)メチルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシド0.4gをピリジン6mlに懸濁し、氷冷撹拌下無水酢酸0.26gを滴下した。室温で1日撹拌後、氷水にあげ、析出結晶を濾取、水洗した。粗結晶をアセトニトリルより再結晶し、淡黄色針状晶として0.4gの2-〔(5-アセチルアミノベンゾフラン-2-イル)メチルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシドを得た。m. p. 183~184℃。

【0900】適当な出発原料を用い、実施例6と同様にして下記実施例84及び85の化合物を得た。

【0901】実施例7

2-〔(5-アミノベンゾフラン-2-イル)メチルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシド0.8gをジメチルホルムアミド15mlに溶解し、炭酸カリウム0.5g及びN-クロロアセチルモルホリン0.37gを加え、70℃で4時間撹拌した。溶媒を留去し、残渣に水を加え、クロロホルムを抽出し、水洗後無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:酢酸エチル)にて精製し、シュウ酸塩としてエタノールより再結晶し、淡茶色粒状品の2-〔(5-モルホリノカルボニルメチルアミノベンゾフラン-2-イル)メチルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシド40mgを得た。m. p. 159~167℃(分解)。

【0902】 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 3.09 (3H, s)、3.40-3.55 (2H, m)、3.55-3.85 (6H, m)、3.90 (2H, s)、4.78 (2H, d, $J=6$ Hz)、6.60 (1H, s)、6.65 (1H, d, $J=7$ Hz)、6.67 (1H, s)、7.28 (1H, d, $J=7$ Hz)、7.75-7.85 (2H, m)、8.05-8.15 (1H, m)、8.47 (1H, br s)、8.50-8.60 (1H, m)。

【0903】実施例8

2-〔(5-エトキシカルボニルベンゾフラン-2-イル)メチルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシド4.2gを、メタノール50ml及び水14mlに水酸化ナトリウム1.4gを溶解した溶液に加え、一夜室温で撹拌した。メタノールを留去し、残渣に水を加え、塩酸性とし、析出品を濾取、水洗、乾燥し、白色粉末として2-〔(5-カルボキシベンゾフラン-2-イル)メチルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシド3.8gを得た。m. p. 251~252℃(分解)。

【0904】実施例9

2-〔(6-メトキシメトキシ-3-メチルベンゾフラン-2-イル)メチルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシド2.1gをテトラヒドロフ

ラン20ml及びメタノール20mlに溶解し、6N塩酸10mlを加え、1時間還流した。溶媒を留去し、残渣をクロロホルム抽出し、飽和重曹水、水、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を留去し、残渣をジメチルホルムアミド-水より再結晶し、黄色針状晶として1.6gの2-〔(6-ヒドロキシ-3-メチルベンゾフラン-2-イル)メチルアミノカルボニル}-3-メチルキノキサリン-4-オキシドを得た。m. p. 222~223℃(分解)。

【0905】実施例10

2-〔(4-ヒドロキシ-3-メチルベンゾフラン-2-イル)メチルアミノカルボニル}-3-メチルキノキサリン-4-オキシド0.55gをジメチルホルムアミド4mlに溶解し、炭酸カリウム0.41g及び沃化メチル0.19mlを加え60℃で4時間攪拌した。水を加え、析出物を濾取、水洗した。粗結晶を酢酸エチル-n-ヘキサンより再結晶し、黄色プリズム状晶として0.41gの2-〔(4-メトキシ-3-メチルベンゾフラン-2-イル)メチルアミノカルボニル}-3-メチルキノキサリン-4-オキシドを得た。m. p. 196~197℃。

【0906】実施例11

2-〔(ベンゾフラン-2-イル)メチルアミノカルボニル}-3-メチルキノキサリン-4-オキシド0.8gをクロロホルム10mlに溶解し、N-ブロモコハク酸イミド0.47gを加え、7時間還流した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒; n-ヘキサン:酢酸エチル=2:1)にて精製し、酢酸エチル-n-ヘキサンより再結晶し、無色針状晶として0.44gの2-〔(3-ブromoベンゾフラン-2-イル)メチルアミノカルボニル}-3-メチルキノキサリン-4-オキシドを得た。m. p. 170~171℃。

【0907】適当な出発原料を用い、実施例11と同様に下記実施例31、34、38、88、93、98、119、124、125、131及び139の化合物を得た。

【0908】実施例12

2-〔(4-メトキシベンジル)アミノカルボニル}-3-メチルキノキサリン10.5gを無水塩化メチレン150mlに溶解し、氷冷下、三臭化ホウ素の塩化メチレン溶液(1M溶液)105mlを滴下した。室温で2日間攪拌後、冷却し、メタノールで分解し、溶媒を留去した。残渣に水を加え炭酸水素ナトリウムを加えて中和後析出物を濾取、水洗、乾燥した。エタノールより再結晶し、無色針状晶として10.0gの2-〔(4-ヒドロキシベンジル)アミノカルボニル}-3-メチルキノキサリンを得た。m. p. 211~214℃。

【0909】実施例13

2-〔(5-(1-アセトキシエチル)ベンゾフラン-

2-イル)メチルアミノカルボニル}-3-メチルキノキサリン-4-オキシド4.5gをメタノール90mlに溶解し、炭酸カリウム1.8gを加え一夜室温で攪拌した。溶媒を留去し、残渣に水を加えクロロホルム抽出し、水洗後無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を留去し、粗結晶を酢酸エチル-n-ヘキサンより再結晶し、無色粒状晶として3.4gの2-〔(5-(1-ヒドロキシエチル)ベンゾフラン-2-イル)メチルアミノカルボニル}-3-メチルキノキサリン-4-オキシドを得た。m. p. 112~114℃。

【0910】実施例14

2-〔(5-(1-ヒドロキシエチル)ベンゾフラン-2-イル)メチルアミノカルボニル}-3-メチルキノキサリン-4-オキシド0.8gをクロロホルム30mlに溶解し、二酸化マンガ3.6gを加え、6時間還流した。反応液をセライト濾過後濃縮した。残渣を酢酸エチル-n-ヘキサンより再結晶し、淡黄色粒状晶として0.5gの2-〔(5-アセチルベンゾフラン-2-イル)メチルアミノカルボニル}-3-メチルキノキサリン-4-オキシドを得た。m. p. 205~206℃。

【0911】実施例15

2-〔(5-アセチルベンゾフラン-2-イル)メチルアミノカルボニル}-3-メチルキノキサリン-4-オキシド0.7gを無水テトラヒドロフラン20mlに溶解し、氷冷下臭化メチルマグネシウムのジエチルエーテル溶液(1M溶液)2.5mlを滴下した。室温で3時間攪拌後水-塩化アンモニウム水にあげクロロホルム抽出し、水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒; n-ヘキサン:酢酸エチル=1:1)にて精製後、n-ヘキサン-酢酸エチルより再結晶し、淡黄色プリズム状晶として0.1gの2-〔(5-(1-ヒドロキシ-1-メチルエチル)ベンゾフラン-2-イル)メチルアミノカルボニル}-3-メチルキノキサリン-4-オキシドを得た。m. p. 147~150℃。

【0912】実施例16

2-〔(5-(5-テトラゾリル)ベンゾフラン-2-イル)メチルアミノカルボニル}-3-メチルキノキサリン-4-オキシド1.4gをジメチルホルムアミド15mlに溶解し、炭酸カリウム0.97g、沃化メチル0.44gを加え、室温で4時間攪拌した。反応液を氷水にあげ、析出物を濾取し、ジメチルホルムアミド-エタノールより再結晶し、白色粉末状として0.48gの2-〔(5-(2-メチル-5-テトラゾリル)ベンゾフラン-2-イル)メチルアミノカルボニル}-3-メチルキノキサリン-4-オキシドを得た。m. p. 206~209℃。

【0913】適当な出発原料を用い、実施例16と同様

にして下記実施例36及び161～164の化合物を得た。

【0914】実施例17

2-〔(4-メトキシカルボニルメトキシベンジル)アミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン3.65gをメタノール50mlに溶解し、2N水酸化ナトリウム6mlを加え、室温で2時間攪拌した。溶媒を留去し、水を加え、塩酸酸性として析出物を回収、水洗、乾燥し、白色粉末として3.40gの2-〔(4-カルボキシメトキシベンジル)アミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリンを得た。

【0915】 $^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm; 2.83 (3H, s)、4.48 (2H, d, $J=6\text{Hz}$)、4.66 (2H, s)、6.91 (2H, d, $J=9\text{Hz}$)、7.33 (2H, d, $J=9\text{Hz}$)、7.8-8.0 (2H, m)、8.0-8.2 (2H, m)、9.33 (1H, t, $J=6\text{Hz}$)。

【0916】適当な出発原料を用い、実施例17と同様にして下記実施例49を得た。

【0917】実施例18

2-〔(4-カルボキシメトキシベンジル)アミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン1.05gをジメチルホルムアミド10mlに溶解し、フルフリルアミン0.35gを加え、氷冷下シアノリン酸ジエチル0.6g及びトリエチルアミン0.6gを順次滴下した。室温で一晩攪拌後、氷水にあげ、析出物を回収した。アセトン-n-ヘキサンより再結晶し、白色粉末として0.92gの2-〔(4-フルフリルアミノカルボニルメトキシベンジル)アミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリンを得た。m. p. 175～176℃。

【0918】実施例19

2-〔(4-メトキシカルボニルメトキシベンジル)アミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン0.73g及び2-メトキシエチルアミン1.1mlをトルエン10mlに溶解し、3時間還流した。溶媒を留去し、残渣を酢酸エチルより再結晶し、白色粉末として0.95gの2-〔〔4-(2-メトキシエチルアミノカルボニルメトキシ)ベンジル〕アミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリンを得た。m. p. 138～140℃。

【0919】適当な出発原料を用い、前記実施例18又は19と同様にして下記実施例46、47、66、82、83、109、110、127、138、146～153、157～159、161～170、173～175、186、187、191～193、195及び196の化合物を得た。

【0920】実施例20

2-〔(4-ヒドロキシベンジル)アミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン1.8gを酢酸30ml及びクロロホルム150mlに溶解し、臭素0.32mlの酢酸(5ml)溶液を室温下に滴下し、同温度で3時間

攪拌した。反応液を飽和重曹水で洗浄し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を留去し、黄色粉末として1.0gの2-〔(3-ブロモ-4-ヒドロキシベンジル)アミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリンを得た。これを実施例10と同様の方法でN-クロロアセチルモルホリンと反応させた後、酢酸エチル-n-ヘキサンより再結晶し、無色針状晶として0.6gの2-〔(3-ブロモ-4-モルホリノカルボニルメトキシベンジル)アミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリンを得た。m. p. 142～143℃。

【0921】適当な出発原料を用い、前記実施例10又は20と同様にして下記実施例45、51、56、58～60、64～66、78、79、82～83、87、106、108、110、116、117、120、121、123、126、127、138、140～142、144、146～153、156～164、167～177、182、185～193、195、196、202、207、210～212、222～224、230～234及び241の化合物を得た。

【0922】実施例21

2-〔(4-メトキシカルボニルベンジル)アミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン0.75gをテトラヒドロフラン40mlに溶解し、氷冷攪拌下、水素化リチウムアルミニウム0.17gを徐々に加えた。同温度で3時間攪拌後10%水酸化ナトリウム水溶液0.3ml及び水0.3mlを順次加えて分解後、セライト通過し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を留去し、2-〔(4-ヒドロキシメチルベンジル)アミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン0.44gを黄色粉末として得た。

【0923】 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 1.75 (1H, t, $J=6\text{Hz}$)、4.70 (4H, d, $J=6\text{Hz}$)、7.3-7.5 (4H, m)、7.7-7.9 (2H, m)、8.0-8.1 (2H, m)、8.39 (1H, brs)。

【0924】実施例22

水素化リチウムアルミニウム1.9gをテトラヒドロフラン100mlに懸濁し、氷冷下2-〔(4-メトキシカルボニルメトキシベンジル)アミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン9.5gのテトラヒドロフラン50ml溶液を徐々に滴下した。滴下終了後、同温度で30分間攪拌し、次いで室温で2時間反応させた。反応終了後、氷冷下、酢酸エチルを加え、次いで飽和塩化アンモニウム水溶液を加えた。不溶物を回収後、酢酸エチルで抽出し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒留去後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:酢酸エチル:n-ヘキサン=1:4)に付し、黄色液体の2-〔〔4-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンジル〕アミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン1.0gを得た。

【0925】 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 2.25 (1H, br)、3.17 (3H, s)、3.9-4.1 (4H, m)、4.63 (2H, d, $J=6$ Hz)、6.92 (2H, d, $J=7$ Hz)、7.34 (2H, d, $J=7$ Hz)、7.7-7.9 (2H, m)、8.0-8.1 (2H, m)、8.34 (1H, br)。

【0926】実施例23

2-〔〔4-(2-ヒドロキシエトキシ)ベンジル〕アミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン0.2g及びトリフェニルホスフィン0.17gを四塩化炭素10mlに溶かし、1.5時間加熱還流した。反応終了後、溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:酢酸エチル:n-ヘキサン=1:2)に付し、黄色液体の2-〔〔4-(2-クロロエトキシ)ベンジル〕アミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリンを0.10g得た。

【0927】 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm; 3.17 (3H, s)、3.82 (2H, t, $J=6$ Hz)、4.24 (2H, t, $J=6$ Hz)、4.64 (2H, d, $J=6$ Hz)、6.93 (2H, d, $J=9$ Hz)、7.35 (2H, d, $J=9$ Hz)、7.7-7.9 (2H, m)、8.0-8.1 (2H, m)、8.33 (1H, br)。

【0928】実施例24

2-〔〔4-クロロエトキシ)ベンジル〕アミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン100mgとモルホリン0.21mlとをジメチルホルムアミド10mlに溶かし、次いで沃化ナトリウム1.2g及び炭酸カリウム300mgを加え、60℃で7.5時間加熱した。反応終了後、氷水にあげ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水及び飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:酢酸エチル:n-ヘキサン=2:3)に付し、黄色液体を得た。次いでエタノールに溶かし、エタノール-塩酸溶液を加え、乾固させた。得られた結晶をエタノール-ジエチルエーテルより再結晶し、黄色粉末の2-〔〔4-(2-モルホリノエトキシ)ベンジル〕アミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン塩酸塩70mg得た。m. p. 155~158℃(分解)。

【0929】適当な出発原料を用い、実施例24と同様にして下記実施例203の化合物を得た。

【0930】実施例25

2-〔〔4-(2-メチル-1,3-ジオキサラン-2

イル)ベンジル〕アミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシド1.3gをアセトン20ml及びジクロロメタン10mlに溶解し、p-トルエンスルホン酸60mgを加え、室温で5時間攪拌した。溶媒を留去し、残渣を酢酸エチル抽出し、飽和重曹水で洗浄後、無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を留去し、残渣をエタノールより再結晶し、淡黄色針状品として1.0gの2-〔〔4-アセチルベンジル〕アミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシドを得た。m. p. 165~167℃。

【0931】実施例26

2-〔2-(4-メトキシフェニルチオ)エチルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシド2.4gを塩化メチレン40mlに溶解し、氷冷下m-クロロ過安息香酸1.4gを徐々に加え、同温度で1時間攪拌した。反応液をチオ硫酸ナトリウム水溶液、飽和重曹水、水で洗浄し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルクロマトグラフィー(溶出溶媒:酢酸エチル)で精製し、エタノールより再結晶し、無色針状品として1.8gの2-〔2-(4-メトキシフェニルスルフィニル)エチルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシドを得た。m. p. 156~157℃。

【0932】適当な出発原料を用い、実施例26と同様にして下記実施例212及び217~220の化合物を得た。

【0933】実施例27

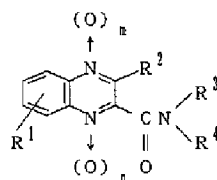
2-〔2-(4-メトキシフェニルチオ)エチルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシド2.4gを塩化メチレン40mlに溶解し、氷冷下m-クロロ過安息香酸2.8gを徐々に加え、同温度で1時間反応した。反応液をチオ硫酸ナトリウム水溶液、飽和重曹水、水で洗浄し、無水硫酸ナトリウム上で乾燥した。溶媒を留去し、残渣をエタノールより再結晶し、無色針状品として2.1gの2-〔2-(4-メトキシフェニルスルホニル)エチルアミノカルボニル〕-3-メチルキノキサリン-4-オキシドを得た。m. p. 148~150℃。

【0934】適当な出発原料を用い、実施例27と同様にして下記実施例218及び220の化合物を得た。

【0935】適当な出発原料を用い、前記実施例1、2又は3と同様にして下記表77~表135に記載の化合物を得た。

【0936】

【表77】



実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ -\text{C}-\text{N} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (℃)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
28	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CNHCH}_2 \end{array} \text{2-methyl-1-benzofuran}$	154 — 157	無色針状 (エタノール)	1	0
29	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CNHCH}_2 \end{array} \text{2-methyl-1-benzothiophene}$	169 — 170	無色針状 (エタノール)	1	0
30	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CNHCH}_2 \end{array} \text{2-methyl-1-benzoxazole}$	143 — 144	無色針状 (エタノール)	1	0

【0937】

【表78】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ -\text{C}-\text{N} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (℃)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
31	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CNHCH}_2 \end{array} \text{2-methyl-1-(4-chlorophenyl)-1H-benzofuran}$	121 — 128	淡黄色針状 (エタノール)	1	0
32	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CNHCH}_2 \end{array} \text{2-methyl-1-(2,3-dihydrobenzofuran-2-yl)-1H-benzofuran}$	173 — 174	橙色粒状 (エタノール)	1	0
33	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CNHCH}_2 \end{array} \text{2-methyl-1-(4-nitrophenyl)-1H-benzofuran}$	192 — 195	淡黄色粒状 (ジメチルホルムアミド-水)	1	0
34	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CNHCH}_2 \end{array} \text{2-methyl-1-(2-chlorophenyl)-1H-benzofuran}$	180 — 182	淡黄色粉末状 (エタノール-水)	1	0
35	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CNHCH}_2 \end{array} \text{2-methyl-1-(4-methoxyphenyl)-1H-benzofuran}$	149 — 151	無色粒状 (n-ヘキサン-酢酸エチル)	1	0

【0938】

【表79】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ -\text{CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \\ \text{R}^4 \end{array}$ (塩)	融点 (℃)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
36	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CNHCH}_2-\text{C}_5\text{H}_4\text{N}-\text{CH}_3 \end{array}$	171 - 177	淡黄色針状 (エタノール)	1	0
37	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CNHCH}_2-\text{C}_5\text{H}_4\text{N}-\text{H} \end{array}$	210 - 212 (分解)	淡黄色プリズム 状 (n-ヘキサン -酢酸エチル)	1	0
38	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CNHCH}_2-\text{C}_6\text{H}_3\text{O}-\text{OCH}_3 \\ \text{Br} \end{array}$	215 - 217 (分解)	無色鱗片状 (アセトニ トリル)	1	0
39	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CNHCH}_2-\text{C}_6\text{H}_3\text{O}-\text{NHCCH}_3 \end{array}$	183 - 184	淡黄色針状 (アセトニ トリル)	1	0

【0939】

【表80】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ -\text{CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \\ \text{R}^4 \end{array}$ (塩)	融点 (℃)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
40	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CNHCH}_2-\text{C}_6\text{H}_3\text{O}-\text{NH}_2 \end{array}$	182 - 183	黄色粉末状 (n-ヘキサン -酢酸エチル)	1	0
41	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CNHCH}_2-\text{C}_6\text{H}_3\text{O}-\text{OCH}_3 \end{array}$	173 - 174	淡赤色針状 (エタノール)	1	0
42	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CNHCH}_2-\text{C}_6\text{H}_3\text{O}-\text{CN} \end{array}$	214 - 215 (分解)	黄色粒状 (アセト ニトリル)	1	0
43	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CNHCH}_2-\text{C}_6\text{H}_3\text{O}-\text{CO}_2\text{CH}_3 \end{array}$	187 - 189	淡黄色針状 (エタノール)	1	0
44	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CNHCH}_2-\text{C}_6\text{H}_3\text{O}-\text{N}(\text{CH}_3)_2 \end{array}$	155 - 157	黄色板状 (アセト ニトリル)	1	0

【0940】

【表81】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ -\text{C}-\text{N} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
45	H	CH ₃		159 — 160	無色針状 (アセト ニトリル)	1	0
46	H	CH ₃		183 — 184	白色粉末状 (2-プロパ ノール)	1	0
47	H	CH ₃		146 — 148	無色針状 (2-プロパ ノール)	1	0
48	H	CH ₃		168 — 169	淡黄色プリズム 状 (アセトニト リル)	1	0

【0941】

【表82】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ -\text{C}-\text{N} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
49	H	CH ₃		202 — 204	無色針状 (エタノール —水)	1	0
50	H	CH ₃		251 — 252 (分解)	白色粉末状	1	0
51	H	CH ₃		120 — 122	無色針状 (n-ヘキサン —酢酸エチル)	1	0
52	H	CH ₃	 (CO ₂ H) ₂	159 — 167 (分解)	淡褐色粒状 (エタノール)	1	0

【0942】

【表83】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ -\text{CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \\ \text{R}^4 \end{array}$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
53	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \quad \text{H}_3\text{C} \\ \parallel \quad \diagup \\ -\text{CNHCH}_2 \quad \text{C} \\ \diagdown \quad \diagup \\ \text{O} \quad \text{OH} \end{array}$	222 — 223 (分解)	黄色針状 (ジメチルホルムアミド-水)	1	0
54	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CNHCH}_2 \quad \text{C} \\ \diagdown \quad \diagup \\ \text{O} \end{array}$	156 — 158	無色針状 (n-ヘキサン 酢酸エチル)	1	0
55	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \quad \text{H}_3\text{C} \\ \parallel \quad \diagup \\ -\text{CNHCH}_2 \quad \text{C} \\ \diagdown \quad \diagup \\ \text{O} \quad \text{OH} \end{array}$	237 — 238 (分解)	黄色粒状 (ジメチルホルムアミド-水)	1	0
56	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \quad \text{H}_3\text{C} \\ \parallel \quad \diagup \\ -\text{CNHCH}_2 \quad \text{C} \\ \diagdown \quad \diagup \\ \text{O} \quad \text{OCH}_2\text{OCH}_3 \end{array}$	130 — 132	白色粉末状	1	0
57	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \quad \text{H}_3\text{C} \\ \parallel \quad \diagup \\ -\text{CNHCH}_2 \quad \text{C} \\ \diagdown \quad \diagup \\ \text{O} \quad \text{OCH}_3 \end{array}$	196 — 197	黄色プリズム状 (n-ヘキサン -酢酸エチル)	1	0

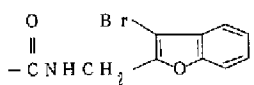
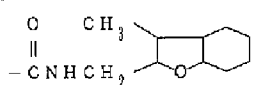
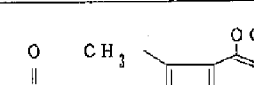
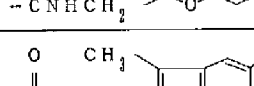
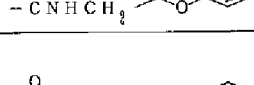
【0943】

【表84】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ -\text{CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \\ \text{R}^4 \end{array}$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
58	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \quad \text{CH}_3 \\ \parallel \quad \diagup \\ -\text{CNHCH}_2 \quad \text{C} \\ \diagdown \quad \diagup \\ \text{O} \quad \text{OCH(CH}_3)_2 \end{array}$	123 — 124	黄色板状 (エタノール)	1	0
59	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \quad \text{CH}_3 \\ \parallel \quad \diagup \\ -\text{CNHCH}_2 \quad \text{C} \\ \diagdown \quad \diagup \\ \text{O} \quad \text{O}-(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3 \end{array}$	177 — 178	淡黄色針状 (エタノール)	1	0
60	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \quad \text{CH}_3 \\ \parallel \quad \diagup \\ -\text{CNHCH}_2 \quad \text{C} \\ \diagdown \quad \diagup \\ \text{O} \quad \text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2 \end{array}$	155 — 156	淡黄色針状 (ジメチルホルムアミド)	1	0
61	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \quad \text{CH}_3 \\ \parallel \quad \diagup \\ -\text{CNHCH}_2 \quad \text{C} \\ \diagdown \quad \diagup \\ \text{O} \quad \text{OH} \end{array}$	220 — 221	淡黄色針状 (ジメチルホルムアミド-水)	1	0

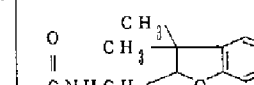
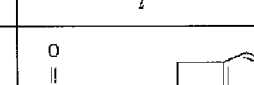
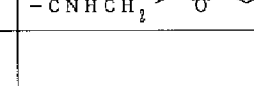
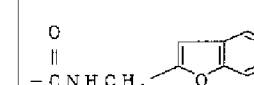
【0944】

【表85】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ -\text{CN} \\ \diagdown \\ \text{R}^4 \end{array}$ $\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{O} \end{array}$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
62	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{CNHCH}_2 \end{array}$ 	170 — 171	無色針状 (n-ヘキサン 酢酸エチル)	1	0
63	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{CNHCH}_2 \end{array}$ 	125 — 126	無色針状 (n-ヘキサン 酢酸エチル)	1	0
64	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{CNHCH}_2 \end{array}$ 	166 — 168	白色粉末状	1	0
65	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{CNHCH}_2 \end{array}$ 	114 — 116	白色粉末状	1	0
66	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{CNHCH}_2 \end{array}$ 	184 — 186	白色粉末状 (アセトニト リル)	1	0

【0945】

【表86】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ -\text{CN} \\ \diagdown \\ \text{R}^4 \end{array}$ $\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ \text{O} \end{array}$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
67	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{CNHCH}_2 \end{array}$ 	160 — 161	無色粒状 (酢酸エチル- n-ヘキサン)	1	0
68	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{CNHCH}_2 \end{array}$ 	70 — 72	淡黄色粉末状 (酢酸エチル- n-ヘキサン)	1	0
69	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{CNHCH}_2 \end{array}$ 	89 — 90	無色粒状 (エタノール)	1	0
70	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{CNHCH}_2 \end{array}$ 	112 — 114	無色粒状 (n-ヘキサン -酢酸エチル)	1	0

【0946】

【表87】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{--CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
71	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{--CNHCH}_2 \end{array} \text{---} \text{2,3-epoxy-4-(ethyl ester)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalene}$	184 — 185	淡黄色棒状 (アセト ニトリル)	1	0
72	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{--CNHCH}_2 \end{array} \text{---} \text{2,3-epoxy-4-(trifluoromethyl)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalene}$	153 — 155	無色針状 (n-ヘキサン —酢酸エチル)	1	0
73	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{--CNHCH}_2 \end{array} \text{---} \text{2,3-epoxy-4-(trifluoromethyl)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalene}$	160 — 162	無色針状 (n-ヘキサン —酢酸エチル)	1	0
74	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{--CNHCH}_2 \end{array} \text{---} \text{2,3-epoxy-4-(methyl)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalene}$	143 — 144	淡黄色針状 (エタノール)	1	0

【0947】

【表88】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{--CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
75	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{--CNHCH}_2 \end{array} \text{---} \text{2,3-epoxy-4-(methyl)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalene}$	199 — 201	淡黄色針状 (エタノール)	1	0
76	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{--CNHCH}_2 \end{array} \text{---} \text{2,3-epoxy-4-(4-azido-2-phenyl-1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-yl)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalene}$	256 — 258 (分解)	黄色粉末状 (ジメチルホル ムアミド—エ タノール)	1	0
77	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{--CNHCH}_2 \end{array} \text{---} \text{2,3-epoxy-4-(4-acetyl-2-phenyl-1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-yl)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalene}$	205 — 206	淡黄色粒状 (n-ヘキサン —酢酸エチル)	1	0
78	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{--CNHCH}_2 \end{array} \text{---} \text{2,3-epoxy-4-(4-methoxy-2-phenyl-1,2,3,4-tetrahydronaphthalen-1-yl)-1,2,3,4-tetrahydronaphthalene}$	154 — 155	淡黄色粉末状 (エタノール)	1	0

【0948】

【表89】

実施例	R ¹	R ²	$ \begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ -\text{CN} \\ \parallel \\ \text{O} \\ \diagdown \\ \text{R}^4 \end{array} $ (塩)	融点 (℃)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
79	H	CH ₃	$ \begin{array}{c} \text{O} \quad \text{H}_3\text{C} \\ \parallel \quad \diagup \\ -\text{CNHCH}_2 \quad \text{C} \\ \quad \quad \quad \diagdown \quad \diagup \\ \quad \quad \quad \text{O} \quad \text{C}_6\text{H}_4 \quad \text{OCH}_3 \end{array} $	169 — 170	無色プリズム状 (エタノール)	1	0
80	H	CH ₃	$ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CNHCH}_2 \quad \text{CH}=\text{CH} \quad \text{C}_6\text{H}_4 \quad \text{O} \end{array} $	133 — 135	褐色粉末状 (エタノール)	1	0
81	H	CH ₃	$ \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ -\text{CNH}(\text{CH}_2)_3 \quad \text{C}_6\text{H}_4 \quad \text{O} \end{array} $	112 — 114	淡黄色板状 (エタノール)	1	0
82	H	CH ₃	$ \begin{array}{c} \text{O} \quad \text{H}_3\text{C} \\ \parallel \quad \diagup \\ -\text{CNHCH}_2 \quad \text{C} \\ \quad \quad \quad \diagdown \quad \diagup \\ \quad \quad \quad \text{O} \quad \text{C}_6\text{H}_4 \quad \text{O} \quad \text{C}(=\text{O}) \quad \text{N} \quad \text{C}_4\text{H}_8\text{N} \end{array} $	189 — 190	淡黄色棒状 (ジメチルホルムアミド— エタノール)	1	0

【0949】

【表90】

実施例	R ¹	R ²	$ \begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN—} \\ \parallel \\ \text{O} \\ \diagdown \\ \text{R}^4 \end{array} $ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
83	H	CH ₃		177 — 178	淡黄色粉末状 (ジメチルホルムアミド—エタノール)	1	0
84	H	CH ₃		230 — 232	白色粉末状 (ジメチルホルムアミド—水)	1	0
85	H	CH ₃		218 — 220	白色粉末状 (酢酸エチル)	1	0
86	H	CH ₃		214 — 215	淡黄色針状 (ジメチルホルムアミド—水)	1	0

【0950】

【表9 1】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \\ -\text{CN} \\ \\ \text{O} \\ \\ \text{R}^4 \end{array}$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
87	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{CNHCH}_2- \end{array} \text{C}_6\text{H}_3\text{OCH}_2\text{OCH}_3$	146 — 147	白色粉末状	1	0
88	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{CNHCH}_2- \end{array} \text{C}_6\text{H}_3\text{SCl}$	180 — 181	無色鱗片状 (ジメチルホルムアミド-水)	1	0
89	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{CNHCH}_2- \end{array} \text{C}_6\text{H}_3\text{S}$	186 — 188	無色針状 (クロロホルム-n-ヘキサン)	1	0
90	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{CNHCH}_2- \end{array} \text{C}_6\text{H}_3\text{O}$	80 — 83	黄色粉末状 (ジエチルエーテル-n-ヘキサン)	1	0
91	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{CNHCH}_2- \end{array} \text{C}_6\text{H}_3\text{N}$	179 — 180	褐色プリズム状 (アセトン-n-ヘキサン)	1	0

【0951】

【表92】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \\ -\text{CN} \\ \\ \text{O} \\ \\ \text{R}^4 \end{array}$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
92	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \quad \text{CH}_3 \\ \quad \\ -\text{CNHCH}_2- \end{array} \text{C}_6\text{H}_3\text{CO}_2\text{CH}_3$	206 — 207	白色粉末状 (エタノール)	1	0
93	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \quad \text{Br} \\ \quad \\ -\text{CNHCH}- \end{array} \text{C}_6\text{H}_3\text{O}$	139 — 141	無色針状 (エタノール)	1	0
94	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{CNHCH}_2- \end{array} \text{C}_6\text{H}_3\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{OH}$	147 — 150	淡黄色プリズム状 (酢酸エチル-n-ヘキサン)	1	0
95	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \\ -\text{CNHCH}- \end{array} \text{C}_6\text{H}_3\text{O}$	133 — 134	白色粉末状 (エタノール)	1	0

【0952】

【表93】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{---CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \\ \text{R}^4 \end{array}$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
96	H	CH ₃		206 — 209	白色粉末状 (ジメチルホルムアミド-エタノール)	1	0
97	H	CH ₃		117 — 119	淡黄色針状 (エタノール)	1	0
98	H	CH ₃		200 — 202 (分解)	淡黄色粉末状 (エタノール)	1	0
99	H	CH ₃		199 — 200	淡褐色針状 (アセトン-n-ヘキサン)	1	0

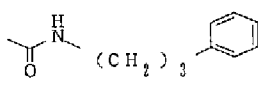
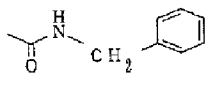
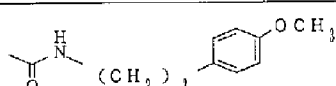
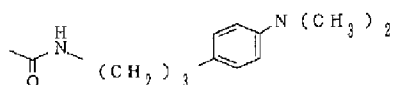
【0953】

【表94】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{---CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \\ \text{R}^4 \end{array}$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
100	H	CH ₃		167 — 168	無色針状 (エタノール)	1	0
101	H	CH ₃		152 — 153	無色針状 (n-ヘキサン-酢酸エチル)	0	1
102	H	CH ₃		130 — 133 (分解)	黄色粉末状 (エタノール)	1	1
103	H	CH ₃		143 — 144	無色針状 (エタノール)	1	0

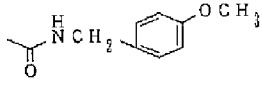
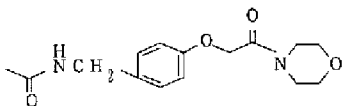
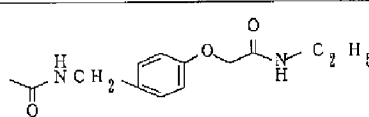
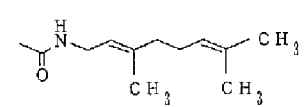
【0954】

【表95】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN—} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
104	H	CH ₃			淡褐色針状 (ジイソプロピ ルエーテル— n-ヘキサン)	0	0
105	H	CH ₃		122 — 124	淡褐色プリズム 状 (ジクロロメタ ン—n-ヘキ サン)	0	0
106	H	CH ₃			淡黄色針状	0	0
107	H	CH ₃			淡黄色針状	0	0

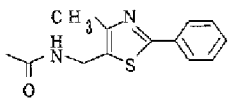
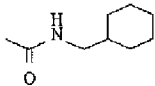
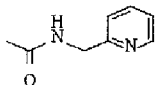
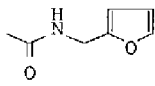
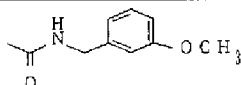
【0955】

【表96】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN—} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
108	H	CH ₃		99 — 100	無色針状 (n-ヘキサン —酢酸エチル)	0	0
109	H	CH ₃		124 — 125	白色粉末状 (酢酸エチル)	0	0
110	H	CH ₃		139 — 140	無色鱗片状 (エタノール —水)	0	0
111	H	CH ₃			淡褐色油状	0	0

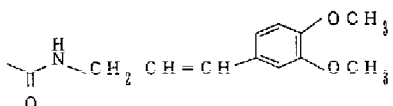
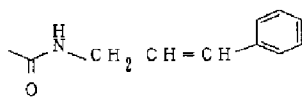
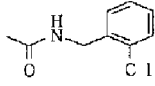
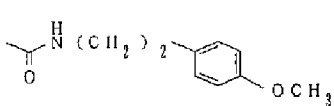
【0956】

【表97】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN—} \\ \diagdown \\ \text{O} \quad \text{R}^4 \end{array}$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
112	H	CH ₃		148 — 150	赤色粉末状 (ジイソプロピ ルエーテル— n-ヘキサン)	0	0
113	H	CH ₃		105 — 106	黄色プリズム状 (n-ヘキサン)	0	0
114	H	CH ₃		135 — 136	無色針状 (n-ヘキサン 酢酸エチル)	0	0
115	H	CH ₃		121 — 122	淡黄色粉末状 (ジイソプロピ ルエーテル— n-ヘキサン)	0	0
116	H	CH ₃		88 — 89	無色針状 (ジイソプロピ ルエーテル)	0	0

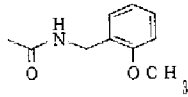
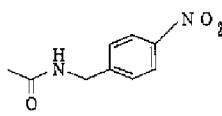
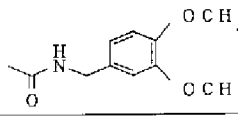
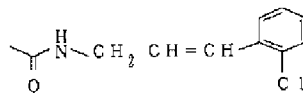
【0957】

【表98】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN—} \\ \diagdown \\ \text{O} \quad \text{R}^4 \end{array}$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
117	H	CH ₃		129 — 130	淡黄色針状 (ジエチル エーテル)	0	0
118	H	CH ₃		106 — 107	無色針状 (n-ヘキサン —ジエチル エーテル)	0	0
119	H	CH ₃		118 — 119	黄色粒状 (ジイソプロピ ルエーテル— n-ヘキサン)	0	0
120	H	CH ₃		101 — 102	淡黄色針状 (ジイソプロピ ルエーテル— n-ヘキサン)	0	0

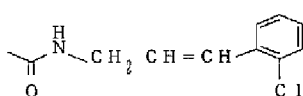
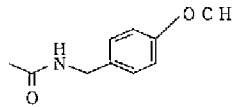
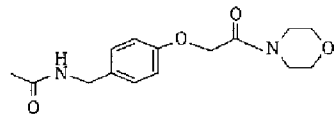
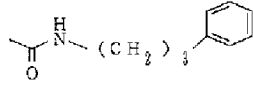
【0958】

【表99】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
121	H	CH ₃		118 — 119	黄色粒状 (ジイソプロピ ルエーテル— n-ヘキサン)	0	0
122	H	CH ₃		184 — 185	橙色粉末状 (ジイソプロピ ルエーテル— n-ヘキサン)	0	0
123	H	CH ₃		148 — 150	黄色板状 (酢酸エチル— n-ヘキサン)	0	0
124	H	CH ₃		124 — 125	無色針状 (ジイソプロピ ルエーテル)	0	0

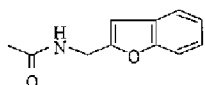
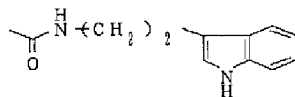
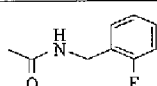
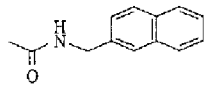
【0959】

【表100】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
125	H	CH ₃		122 — 123	無色鱗片状 (酢酸エチル— n-ヘキサン)	1	0
126	H	CH ₃		115 — 116	淡黄色針状 (酢酸エチル— n-ヘキサン)	1	0
127	H	CH ₃		142 — 143	無色針状 (アセトニト ニトリル)	1	0
128	H	CH ₃		99 — 100	無色針状 (n-ヘキサン 酢酸エチル)	1	0

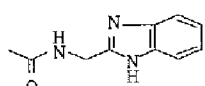
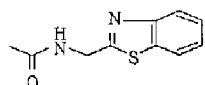
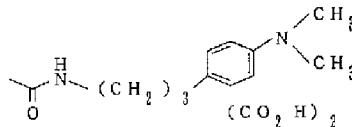
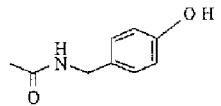
【0960】

【表101】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
129	H	CH ₃		102 — 103	淡黄色粒状 (メタノール —水)	0	0
130	H	CH ₃		211 — 213	黄色針状 (エタノール)	1	0
131	H	CH ₃		123 — 124	無色針状 (エタノール)	1	0
132	H	CH ₃		146 — 147	無色針状 (n-ヘキサン —酢酸エチル)	1	0

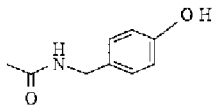
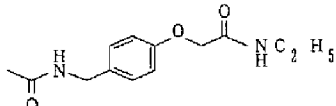
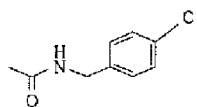
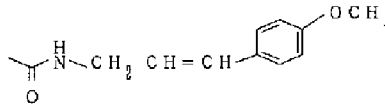
【0961】

【表102】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
133	H	CH ₃		246 — 248 (分解)	橙色針状 (エタノール)	1	0
134	H	CH ₃		188 — 190	橙色針状 (エタノール)	1	0
135	H	CH ₃			橙色粉末状 (アセトン)	1	0
136	H	CH ₃		211 — 214	無色針状 (エタノール)	0	0

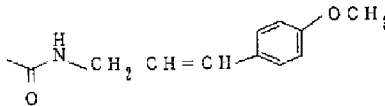
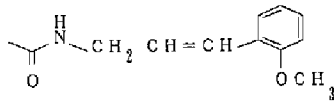
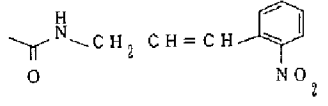
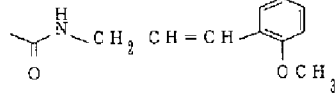
【0962】

【表103】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ -\text{CN} \\ \diagdown \\ \text{R}^4 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
137	H	CH ₃		187 — 192	黄色粒状 (酢酸エテル)	1	0
138	H	CH ₃		190 — 199	無色針状 (酢酸エテル)	1	0
139	H	CH ₃		147 — 148	無色針状 (ジイソプロピ ルエーテル)	0	0
140	H	CH ₃		116 — 117	淡黄色粉末状 (ジイソプロピ ルエーテル)	0	0

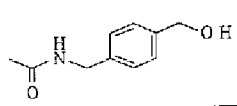
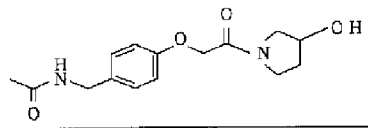
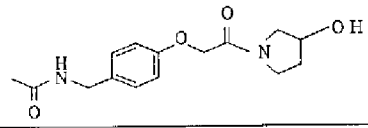
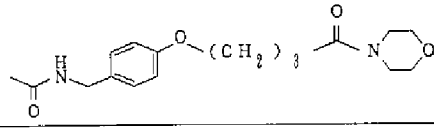
【0963】

【表104】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ -\text{CN} \\ \diagdown \\ \text{R}^4 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
141	H	CH ₃		120 — 122	橙色粉末状 (酢酸エチル— n-ヘキサン)	1	0
142	H	CH ₃		127 — 128	黄色針状 (酢酸エチル— n-ヘキサン)	0	0
143	H	CH ₃		128 — 130	無色針状 (n-ヘキサン —酢酸エチル)	1	0
144	H	CH ₃		123 — 124	無色針状 (n-ヘキサン —酢酸エチル)	1	0

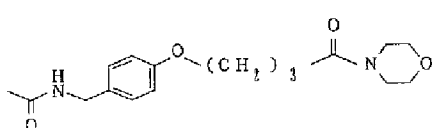
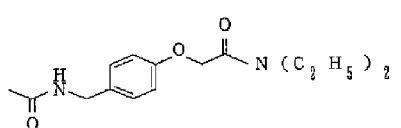
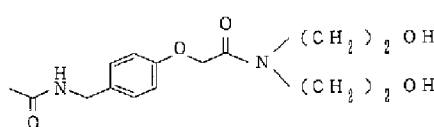
【0964】

【表105】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
145	H	CH ₃		171 — 173	黄色プリズム状 (イソプロパノール-ジイソプロピルエーテル)	1	0
146	H	CH ₃		176 — 177	淡黄色粒状 (イソプロパノール-ジイソプロピルエーテル)	1	0
147	H	CH ₃		148 — 149	無色鱗片状 (酢酸エチル-n-ヘキサン)	0	0
148	H	CH ₃		119 — 120	無色針状 (酢酸エチル-n-ヘキサン)	1	0

【0965】

【表106】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
149	H	CH ₃		135 — 137	白色粉末状	0	0
150	H	CH ₃		118 — 119	白色粉末状 (酢酸エチル-n-ヘキサン)	1	0
151	H	CH ₃		135 — 137	無色プリズム状 (アセトン)	0	0

【0966】

【表107】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
152	H	CH ₃		196 — 198	無色針状 (アセトン— <i>n</i> —ヘキサン)	1	0
153	H	CH ₃		133 — 134	無色鱗片状 (酢酸エチル— <i>n</i> —ヘキサン)	0	0
154	H	CH ₃		225 — 226	無色針状 (ジメチルホルムアミド)	1	0
155	H	CH ₃		98 — 100	無色針状 (酢酸エチル— <i>n</i> —ヘキサン)	1	0

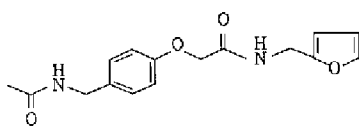
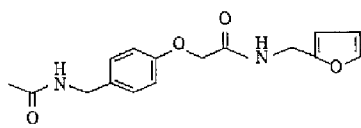
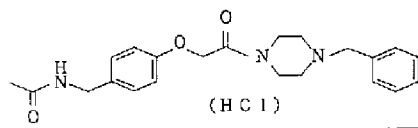
【0967】

【表108】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
156	H	CH ₃		100 — 101	淡黄色粉末状 (酢酸エチル)	1	0
157	H	CH ₃		144 — 145	無色針状 (酢酸エチル— <i>n</i> —ヘキサン)	1	0
158	H	CH ₃		133 — 134	無色針状 (酢酸エチル— <i>n</i> —ヘキサン)	0	0

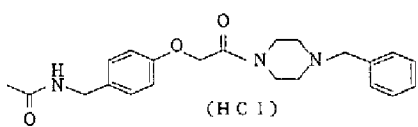
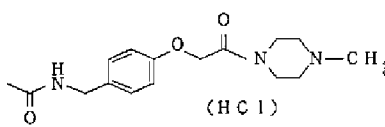
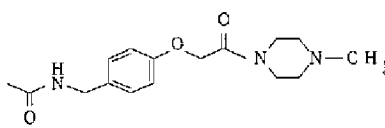
【0968】

【表109】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN—} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
159	H	CH ₃		83 — 87	淡黄色粉末状	1	0
160	H	CH ₃		175 — 176	白色粉末状 (アセトン—n —ヘキサン)	0	0
161	H	CH ₃	 (HCl)	246 — 247 (分解)	白色粉末状 (エタノール— ジエチルエー テル)	1	0

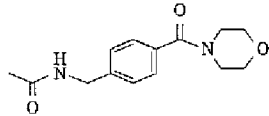
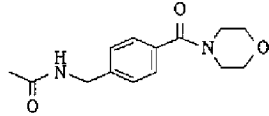
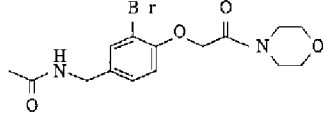
【0969】

【表110】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN—} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
162	H	CH ₃	 (HCl)	214 — 215	無色鱗片状 (メタノール— ジエチルエー テル)	0	0
163	H	CH ₃	 (HCl)	212 — 215 (分解)	白色粉末状	1	0
164	H	CH ₃		139 — 141	無色針状 (酢酸エチル— n—ヘキサン)	0	0

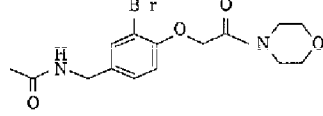
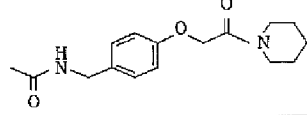
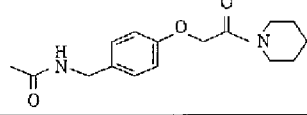
【0970】

【表111】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ -\text{C}-\text{N} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
165	H	CH ₃		170 — 171	無色粒状 (酢酸エチル- n-ヘキサン)	1	0
166	H	CH ₃		152 — 153	無色粒状 (酢酸エチル- n-ヘキサン)	0	0
167	H	CH ₃		165 — 166	無色針状 (酢酸エチル- n-ヘキサン)	1	0

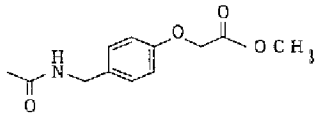
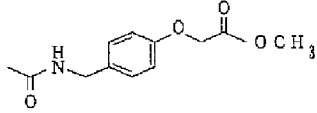
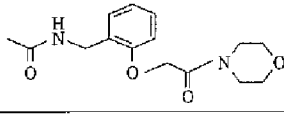
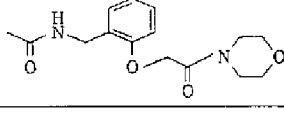
【0971】

【表112】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ -\text{C}-\text{N} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
168	H	CH ₃		142 — 143	無色針状 (酢酸エチル- n-ヘキサン)	0	0
169	H	CH ₃		134 — 135	白色粉末状	1	0
170	H	CH ₃		126 — 128	無色鱗片状 (酢酸エチル- n-ヘキサン)	0	0

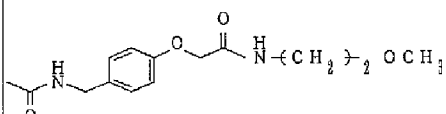
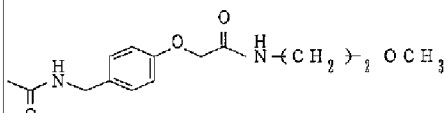
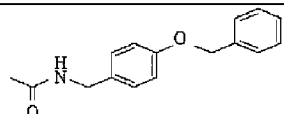
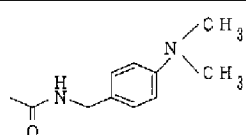
【0972】

【表113】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
171	H	CH ₃		126 — 128	淡黄色針状 (酢酸エチル— n—ヘキサン)	1	0
172	H	CH ₃		106 — 107	白色粉末状 (酢酸エチル— n—ヘキサン)	0	0
173	H	CH ₃		167 — 169	無色プリズム状 (アセトン—n ヘキサン)	1	0
174	H	CH ₃		129 — 130	無色針状 (酢酸エチル— n—ヘキサン)	0	0

【0973】

【表114】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
175	H	CH ₃		135 — 136	白色粉末状 (酢酸エチル— n—ヘキサン)	1	0
176	H	CH ₃		138 — 140	白色粉末状 (酢酸エチル)	0	0
177	H	CH ₃		140 — 141	無色針状 (酢酸エチル)	1	0
178	H	CH ₃		146 — 147	黄色針状 (酢酸エチル— n—ヘキサン)	1	0

【0974】

【表115】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN—} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array}$ $\begin{array}{c} \text{R}^4 \end{array}$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
179	H	CH ₃		154 — 155	無色針状 (酢酸エチル) n-ヘキサン)	1	0
180	H	CH ₃		155 — 156	無色針状 (酢酸エチル) n-ヘキサン)	1	0
181	H	CH ₃		67 — 69	無色針状 (n-ヘキサン ジエチルエー テル)	1	0
182	H	CH ₃		132 — 133	褐色粉末状 (酢酸エチル)	1	0

【0975】

【表116】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN—} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array}$ $\begin{array}{c} \text{R}^4 \end{array}$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
183	H	CH ₃		174 — 175	無色針状 (エタノール)	1	0
184	H	CH ₃		156 — 158	無色針状 (酢酸エチル) n-ヘキサン)	1	0
185	H	CH ₃		102 — 103	無色針状 (酢酸エチル) n-ヘキサン)	0	0
186	H	CH ₃			黄色油状	0	0

【0976】

【表117】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{--CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
187	H	CH ₃			黄色油状	1	0
188	H	CH ₃		123 — 124	無色針状 (酢酸エチル— n-ヘキサン)	1	0
189	H	CH ₃		149 — 151	白色粉末状 (酢酸エチル— n-ヘキサン)	1	0

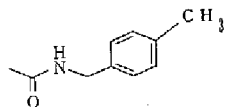
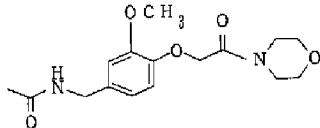
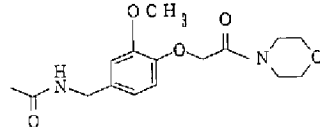
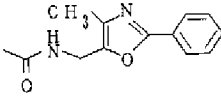
【0977】

【表118】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{--CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
190	H	CH ₃			黄色粉末状	0	0
191	H	CH ₃		122 — 123	無色プリズム状 (酢酸エチル— n-ヘキサン)	1	0
192	H	CH ₃		110 — 112	白色粉末状 (メタノール— ジエチルエー テル)	1	0
193	H	CH ₃		193 — 195	黄色針状 (ジメチルホル ムアミド— 水)	0	0

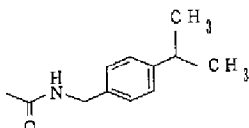
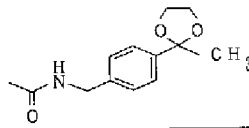
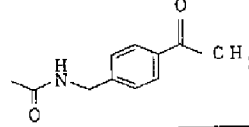
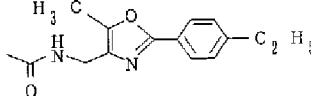
【0978】

【表119】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \quad \text{R}^4 \end{array}$ (塩)	融点 (℃)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
194	H	CH ₃		152 — 153	無色針状 (ジイソプロピ ルエーテル)	1	0
195	H	CH ₃		164 — 165	白色粉末状 (酢酸エチル)	0	0
196	H	CH ₃		144 — 145	黄色粒状 (酢酸エチル— n-ヘキサン)	1	0
197	H	CH ₃		195 — 196	無色針状 (エタノール)	1	0

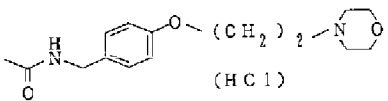
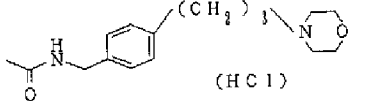
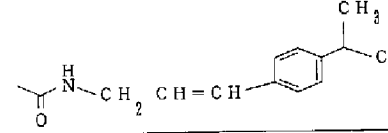
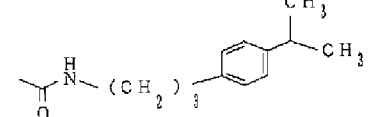
【0979】

【表120】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \quad \text{R}^4 \end{array}$ (塩)	融点 (℃)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
198	H	CH ₃		105 — 107	淡黄色針状 (ジクロロメタ ン—n-ヘキサ ン)	1	0
199	H	CH ₃		159 — 160	淡黄色鱗片状 (エタノール)	1	0
200	H	CH ₃		165 — 167	淡黄色針状 (エタノール)	1	0
201	H	CH ₃		195 — 196	無色針状 (酢酸エチル— n-ヘキサン)	1	0

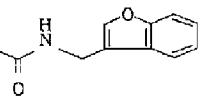
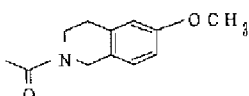
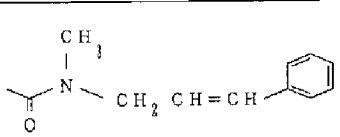
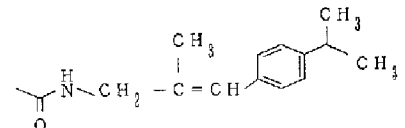
【0980】

【表121】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN—} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
202	H	CH ₃	 (HCl)	155 — 158 (分解)	黄色粉末状 (エタノール— ジエテル エーテル)	0	0
203	H	CH ₃	 (HCl)	116 — 118	黄色粒状 (エタノール— ジエテル エーテル)	0	0
204	H	CH ₃		118 — 120	無色針状 (エタノール)	1	0
205	H	CH ₃		56 — 58	無色針状 (エタノール)	1	0

【0981】

【表122】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN—} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4$ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
206	H	CH ₃		133 — 134	淡褐色プリズム 状 (イソプロパ ノール—水)	0	0
207	H	CH ₃		170 — 171	白色粉末状 (酢酸エチル)	1	0
208	H	CH ₃			淡黄色油状	0	0
209	H	CH ₃			無色油状	1	0

【0982】

【表123】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4 \quad (\text{塩})$	融点 (℃)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
210	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ \text{—N—(CH}_2\text{)}_2\text{—S—} \end{array} \text{C}_6\text{H}_4\text{—OCH}_3$	76 — 77	無色針状 (エタノール)	1	0
211	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ \text{—N—(CH}_2\text{)}_2\text{—S—} \\ \\ \text{O} \end{array} \text{C}_6\text{H}_4\text{—OCH}_3$	156 — 157	無色針状 (エタノール)	1	0
212	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ \text{—N—(CH}_2\text{)}_2\text{—S—} \\ \\ \text{O} \end{array} \text{C}_6\text{H}_4\text{—OCH}_3$	148 — 150	無色針状 (エタノール)	1	0
213	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ \text{—N—(CH}_2\text{)}_2\text{—O—} \end{array} \text{C}_6\text{H}_5$	113 — 114	淡黄色プリズム 状 (n-ヘキサン —酢酸エチル)	1	0

【0983】

【表124】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4 \quad (\text{塩})$	融点 (℃)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
214	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ \text{—N—(CH}_2\text{)}_2\text{—O—} \end{array} \text{C}_6\text{H}_5$	115 — 116	無色針状 (エタノール —水)	0	0
215	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ \text{—N—(CH}_2\text{)}_2\text{—S—} \end{array} \text{C}_6\text{H}_5$	87 — 88	無色針状 (エタノール —水)	0	0
216	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ \text{—N—(CH}_2\text{)}_2\text{—S—} \end{array} \text{C}_6\text{H}_5$	107 — 109	無色針状 (エタノール)	1	0
217	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{H} \\ \\ \text{—N—(CH}_2\text{)}_2\text{—S—} \\ \\ \text{O} \end{array} \text{C}_6\text{H}_5$	132 — 133	無色針状 (エタノール —水)	0	0


【0984】

【表125】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{--CN} \\ \diagdown \\ \text{R}^4 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \quad (\text{塩})$	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
218	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{CH}_3\text{--N--}(\text{CH}_2)_2\text{--S--} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C}_6\text{H}_5 \end{array} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	162 — 163	無色針状 (エタノール)	0	0
219	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{CH}_3\text{--N--}(\text{CH}_2)_2\text{--S--} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C}_6\text{H}_5 \end{array} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	156 — 157	無色針状 (エタノール)	1	0
220	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{CH}_3\text{--N--}(\text{CH}_2)_2\text{--S--} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C}_6\text{H}_5 \end{array} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	181 — 182	無色針状 (エタノール)	1	0
221	H	CF ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{CH}_3\text{--N--}(\text{CH}_2)_2\text{--S--} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C}_6\text{H}_5 \end{array} \\ \parallel \\ \text{O} \end{array}$	155 — 157	無色針状 (n-ヘキサン -酢酸エチル)	0	0


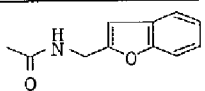
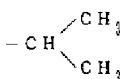
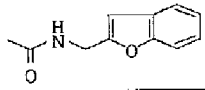
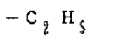
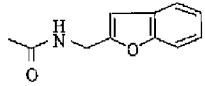
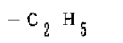
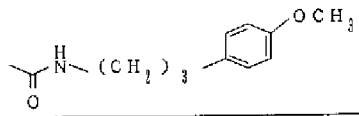
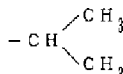
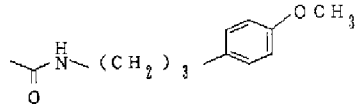
【0985】

【表126】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{--CN} \\ \diagdown \\ \text{R}^4 \\ \parallel \\ \text{O} \end{array} \quad (\text{塩})$	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
222	H	CF ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{CH}_3\text{--N--}(\text{CH}_2)_3\text{--} \begin{array}{c} \text{OCH}_3 \\ \\ \text{C}_6\text{H}_4 \end{array} \end{array}$	115 — 116	無色針状 (n-ヘキサン -酢酸エチル)	0	0
223	H		$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{CH}_3\text{--N--}(\text{CH}_2)_3\text{--} \begin{array}{c} \text{OCH}_3 \\ \\ \text{C}_6\text{H}_4 \end{array} \end{array}$	150 — 151	無色粒状 (n-ヘキサン -酢酸エチル)	0	0
224	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{CH}_3\text{--N--}(\text{CH}_2)_3\text{--} \begin{array}{c} \text{OCH}_3 \\ \\ \text{C}_6\text{H}_4 \end{array} \end{array}$	126	淡黄色鱗片状 (エタノール)	1	0
225	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{CH}_3\text{--N--}(\text{CH}_2)_2\text{--} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C}_6\text{H}_5 \end{array} \end{array}$	155 — 156	無色鱗片状 (n-ヘキサン -酢酸エチル)	0	0
226	H	H	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{CH}_3\text{--N--}(\text{CH}_2)_2\text{--} \begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{C}_6\text{H}_5 \end{array} \end{array}$	211 — 213	淡褐色鱗片状 (アセトニト リル)	1	0

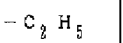
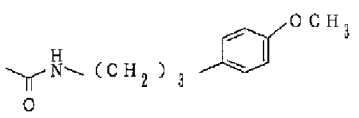

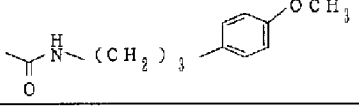
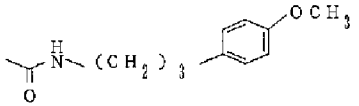

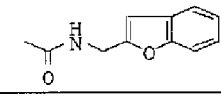

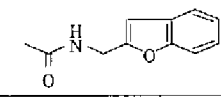
【0986】

【表127】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN—} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array}$ R ⁴ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
227	H			169 — 171	褐色粒状 (n-ヘキサン —酢酸エチル)	0	0
228	H			114 — 116	無色針状 (n-ヘキサン —酢酸エチル)	1	0
229	H			114 — 115	無色プリズム状 (n-ヘキサン —酢酸エチル)	1	0
230	H			87 — 89	無色針状 (n-ヘキサン —酢酸エチル)	1	0
231	H			67 — 68	無色針状 (n-ヘキサン)	0	0

【0987】

【表128】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN—} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array}$ R ⁴ (塩)	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
232	H			82 — 83	淡黄色プリズム 状 (n-ヘキサン)	0	0
233	H			157 — 158	無色針状 (n-ヘキサン —酢酸エチル)	1	0
234	H	H		92 — 93	黄色針状 (n-ヘキサン —酢酸エチル)	0	0
235	H			173 — 174	無色針状 (n-ヘキサン —酢酸エチル)	1	0
236	7- Cl			160 — 161	無色鱗片状 (n-ヘキサン —酢酸エチル)	1	0

【0988】

【表129】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4 \quad (\text{塩})$	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
237	H	$-\text{CH}_2-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \diagdown \diagup \end{array} \text{O}$	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{—NH—CH}_2\text{—CH=CH—} \end{array} \begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_5 \\ (\text{COOH})_2 \end{array}$	156 — 158 (分解)	白色粉末状 (エタノール— ジエチルエー テル)	0	0
238	H	$-\text{CH}_2-\text{N} \begin{array}{c} \diagup \diagdown \\ \diagdown \diagup \end{array} \text{N}$	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{—NH—CH}_2\text{—CH=CH—} \end{array} \begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_5 \\ (\text{COOH})_2 \end{array}$	118 — 119	淡黄色粉末状 (酢酸エチル— n-ヘキサン)	0	0
239	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{—CNHCH}_2\text{—CH=CH}_2 \end{array}$	116 — 118	無色針状 (エタノール)	1	0
240	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{—CNHCH}_2\text{—CH=C} \begin{array}{l} \text{CH}_3 \\ \text{CH}_3 \end{array} \end{array}$	112 — 113	淡黄色針状 (エタノール)	1	0

【0989】

【表130】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4 \quad (\text{塩})$	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
241	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{—CNHCH}_2\text{—} \end{array} \begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_4 \\ \text{OCH}_2\text{CO}_2\text{H} \end{array}$		白色粉末状	0	0
242	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{—CNHCH}_2\text{—} \end{array} \begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_3(\text{Br})(\text{OH}) \end{array}$		黄色粉末状	0	0
243	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{—CNHCH}_2\text{—} \end{array} \begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_4 \\ \text{CO}_2\text{CH}_3 \end{array}$		白色粉末状	0	0
244	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{—CNHCH}_2\text{—} \end{array} \begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_4 \\ \text{CH}_2\text{OH} \end{array}$		黄色粉末状	0	0

【0990】

【表131】

実施例	R ¹	R ²	$\begin{array}{c} \text{R}^3 \\ \diagup \\ \text{—CN} \\ \diagdown \\ \text{O} \end{array} \text{R}^4 \quad (\text{塩})$	融点 (°C)	結晶形 (再結晶溶媒)	m	n
245	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{—CNHCH}_2\text{—} \end{array} \begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_4 \\ \text{O}(\text{CH}_2)_2\text{OH} \end{array}$		黄色油状	0	0
246	H	CH ₃	$\begin{array}{c} \text{O} \\ \parallel \\ \text{—CNHCH}_2\text{—} \end{array} \begin{array}{c} \text{C}_6\text{H}_4 \\ \text{O}(\text{CH}_2)_2\text{Cl} \end{array}$		黄色油状	0	0

【0991】

【表132】

実施例	$^1\text{H-NMR}$ δ (ppm)
186	(CDCl_3) ; 1.11 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.20 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 3.17 (3H, s), 3.3-3.5 (4H, m), 4.6-4.7 (4H, m), 6.89 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.00 (2H, m), 7.30 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.7-7.9 (2H, m), 8.0-8.1 (2H, m), 8.40 (1H, brs)
187	(CDCl_3) ; 1.12 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.21 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 3.10 (3H, s), 3.3-3.5 (4H, m), 4.66 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 4.68 (2H, s), 6.88 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.0-7.1 (2H, m), 7.29 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.7-7.9 (2H, m), 8.0-8.1 (1H, m), 8.39 (1H, br), 8.5-8.6 (1H, m)
190	(CDCl_3) ; 3.17 (3H, s), 3.61 (3H, s), 4.63 (2H, d, $J=6\text{Hz}$), 4.99 (2H, s), 6.9-7.0 (4H, m), 7.3-7.4 (4H, m), 7.7-7.9 (2H, m), 8.0-8.1 (2H, m), 8.31 (1H, br)
208	(CDCl_3) ; 2.78, 2.79 (3H, s), 2.92, 3.24 (3H, s), 3.98, 4.43 (2H, d, $J=6\text{Hz}$), 6.10-6.40 (1H, m), 6.40, 6.70 (1H, d, $J=16\text{Hz}$), 7.20-7.50 (5H, m), 7.70-7.85 (2H, m), 8.00-8.15 (2H, m)

【0992】

【表133】

実施例	$^1\text{H-NMR}$ δ (ppm)
209	(CDCl_3) ; 8.56 (1H, m), 8.20 (1H, br t, $J=6\text{Hz}$), 8.06 (1H, m), 7.77 (2H, m), 7.21 (4H, m), 6.51 (1H, s), 4.22 (2H, d, $J=6\text{Hz}$), 3.07 (3H, s), 2.90 (1H, sept, $J=7\text{Hz}$), 1.98 (3H, s), 1.25 (6H, d, $J=7\text{Hz}$)
245	(CDCl_3) ; 2.25 (1H, br), 3.17 (3H, s), 3.9-4.1 (4H, m), 4.63 (2H, d, $J=6\text{Hz}$), 6.92 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 7.34 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 7.7-7.9 (2H, m), 8.0-8.1 (2H, m), 8.34 (1H, br)
52	(CDCl_3) ; 3.09 (3H, s), 3.40-3.55 (2H, m), 3.55-3.85 (6H, m), 3.90 (2H, s), 4.78 (2H, d, $J=6\text{Hz}$), 6.60 (1H, s), 6.65 (1H, d, $J=7\text{Hz}$), 6.67 (1H, s), 7.28 (1H, d, $J=7\text{Hz}$), 7.75-7.85 (2H, m), 8.05-8.15 (1H, m), 8.47 (1H, br s), 8.50-8.60 (1H, m)
104	(CDCl_3) ; 8.05 (3H, m), 7.78 (2H, m), 7.25 (5H, m), 3.56 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 3.14 (3H, s), 2.77 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 2.04 (2H, quat, $J=7\text{Hz}$)

【0993】

【表134】

実施例	$^1\text{H-NMR}$ δ (ppm)
106	(CDCl_3) ; 8.05 (3H, m), 7.78 (2H, m), 7.15 (2H, d, $J=9\text{Hz}$), 6.84 (2H, d, $J=9\text{Hz}$), 3.76 (3H, s), 3.54 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 3.14 (3H, s), 2.72 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 2.00 (2H, qui, $J=7\text{Hz}$)
107	(CDCl_3) ; 8.03 (3H, m), 7.79 (2H, m), 7.11 (2H, d, $J=9\text{Hz}$), 6.69 (2H, d, $J=9\text{Hz}$), 3.54 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 3.14 (3H, s), 2.88 (6H, s), 2.69 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.99 (2H, qui, $J=7\text{Hz}$)
111	(CDCl_3) ; 1.62 (3H, s), 1.69 (3H, s), 1.77 (3H, s), 2.0-2.2 (4H, m), 3.15 (3H, s), 4.12 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 5.11 (1H, br), 5.36 (1H, br), 7.7-8.2 (4H, m), 7.92 (1H, br)
135	($\text{DMSO}-d_6$) ; 1.75-1.90 (2H, m), 2.54 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 2.63 (3H, s), 2.83 (6H, s), 3.25-3.35 (2H, m), 6.67 (2H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.06 (2H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.85- 7.96 (2H, m), 8.10-8.20 (1H, m), 8.40 -8.50 (1H, m), 8.87 (1H, br s)
246	(CDCl_3) ; 3.17 (3H, s), 3.82 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 4.24 (2H, t, $J=6\text{Hz}$), 4.64 (2H, d, $J=6\text{Hz}$), 6.93 (2H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.35 (2H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.7-7.9 (2H, m), 8.0- 8.1 (2H, m), 8.33 (1H, br)

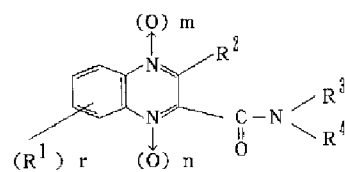
【0994】

【表135】

実施例	$^1\text{H-NMR}$ δ (ppm)
241	(DMSO- d_6) ; 2.83 (3H, s), 4.48 (2H, d, $J=6\text{Hz}$), 4.66 (2H, s), 6.91 (2H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.33 (2H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.8-8.0 (2H, m), 8.0-8.2 (2H, m), 9.33 (1H, t, $J=6\text{Hz}$)
242	(CDCl $_3$) ; 3.17 (3H, s), 4.61 (2H, d, $J=6\text{Hz}$), 5.91 (1H, brs), 7.00 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.26 (1H, dd, $J=2\text{Hz}$, $J=8\text{Hz}$), 7.52 (1H, d, $J=2\text{Hz}$), 7.7-7.9 (2H, m), 8.0-8.1 (2H, m), 8.40 (1H, brs)
243	(CDCl $_3$) ; 3.17 (3H, s), 3.92 (3H, s), 4.77 (2H, d, $J=6\text{Hz}$), 7.48 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.7-7.9 (2H, m), 8.0-8.1 (2H, m), 8.04 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 8.51 (1H, brs)
244	(CDCl $_3$) ; 1.75 (1H, t, $J=6\text{Hz}$), 4.70 (4H, d, $J=6\text{Hz}$), 7.3-7.5 (4H, m), 7.7-7.9 (2H, m), 8.0-8.1 (2H, m), 8.39 (1H, brs)

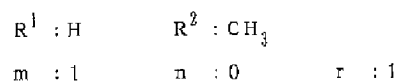
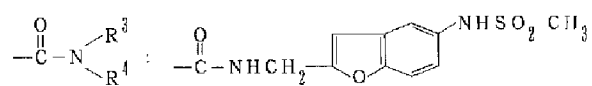
【0995】適当な出発原料を用い、前記実施例1~4と同様にして下記表136~表230に記載の化合物を得た。

【0996】
【表136】



実施例 247

構造



結晶形 : 淡黄色粉末状

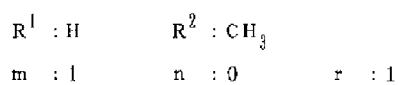
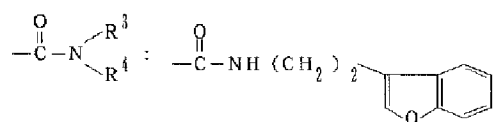
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 206-208℃

形態 : 遊離

実施例 248

構造



結晶形 : 白色粉末状

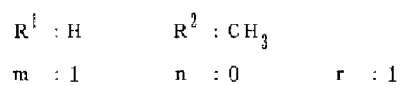
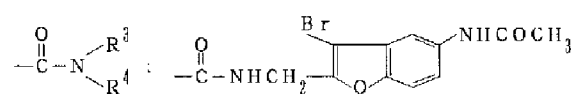
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 142-144℃

形態 : 遊離

実施例 249

構造



結晶形 : 淡黄色針状

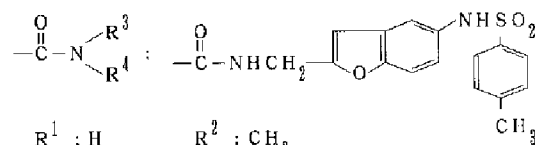
再結晶溶媒 : 酢酸エチル

融点 : 213-214℃

形態 : 遊離

実施例 252

構造

 $\text{R}^1 : \text{H}$ $\text{R}^2 : \text{CH}_3$ $m : 1$ $n : 0$ $r : 1$

結晶形 : 淡褐色粉末状

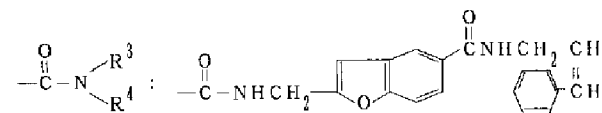
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 198-200°C

形態 : 遊離

実施例 253

構造

 $\text{R}^1 : \text{H}$ $\text{R}^2 : \text{CH}_3$ $m : 1$ $n : 0$ $r : 1$

結晶形 : 淡黄色粒状

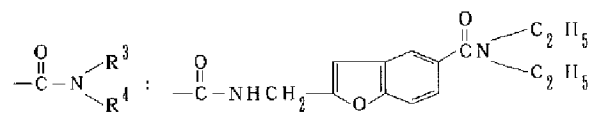
再結晶溶媒 : 2-プロパノール

融点 : 140-141°C

形態 : 遊離

实施例	254
-----	-----

構造


$$\begin{array}{lll} R^1 : H & R^2 : CH_3 & \\ m : 1 & n : 0 & r : 1 \end{array}$$

結 晶 形：白色粉末狀

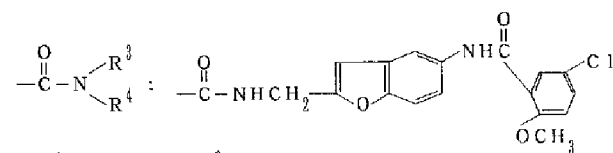
再結晶溶媒 : n-ヘキサン-酢酸エチル

融 点 : 185-190℃

形態：遊離

实施例 255

构造


$$\begin{array}{lll} R^1 : H & R^2 : CH_3 & \\ m : 1 & n : 0 & r : 1 \end{array}$$

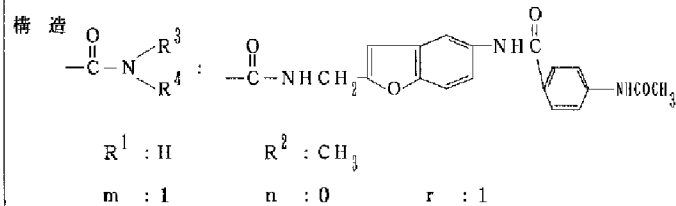
結 晶 形：淡黃色針狀

再結晶溶媒 : アセトニトリル

融 点 : 197—198℃

形態：遊離

実施例 256



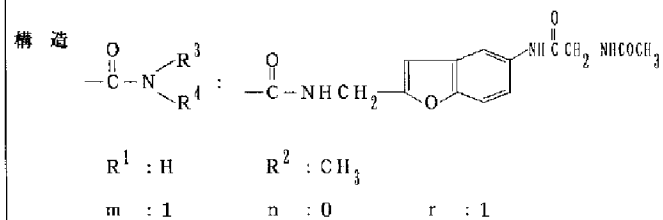
結 晶 形 : 黄色粒状

再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド-水

融 点 : 255-256℃ (分解)

形 態 : 遊 離

実施例 257



結 晶 形 : 淡黄色粉末状

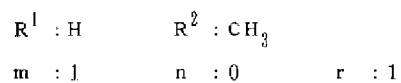
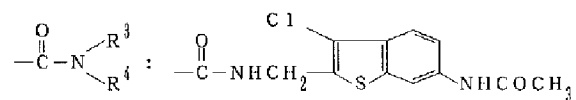
再結晶溶媒 : エタノール

融 点 : 230-231℃ (分解)

形 態 : 遊 離

実施例 260

構造



結晶形 : 黄色粉末状

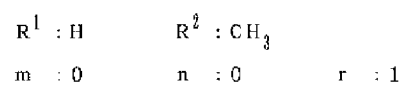
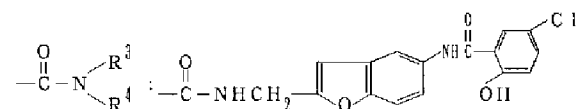
再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド-水

融点 : 248-250℃ (分解)

形態 : 遊離

実施例 261

構造



結晶形 : 白色粉末状

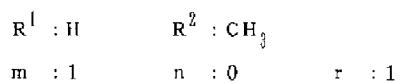
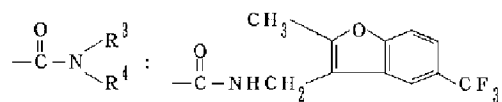
再結晶溶媒 : 酢酸エチル

融点 : 234-236℃

形態 : 遊離

実施例 262

構造



結晶形 : 無色針状

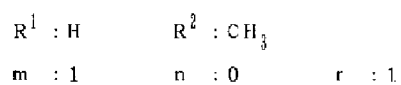
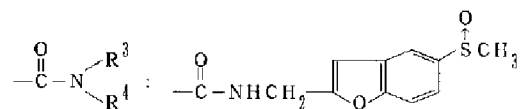
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 193-194℃

形態 : 遊離

実施例 263

構造



結晶形 : 白色粉末状

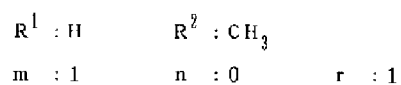
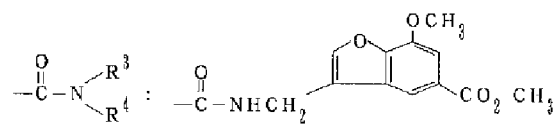
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 166-167℃

形態 : 遊離

実施例 264

構造



結晶形 : 白色粉末状

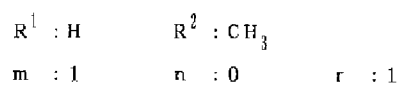
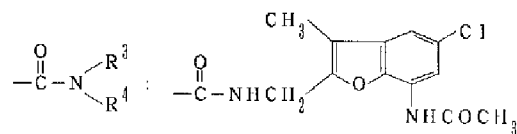
再結晶溶媒 : アセトニトリル

融点 : 212-213℃

形態 : 遊離

実施例 265

構造



結晶形 : 淡黄色粉末状

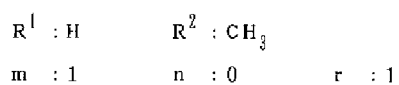
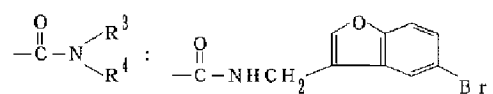
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 246-247℃ (分解)

形態 : 遊離

実施例 266

構造



結晶形 : 無色針状

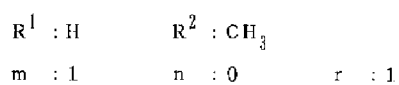
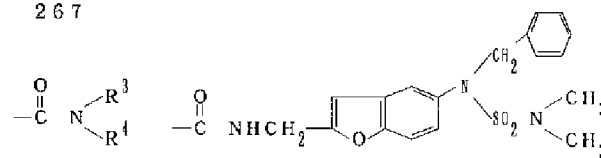
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 197-198℃

形態 : 遊離

実施例 267

構造



結晶形 : 黄色不定形

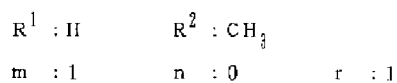
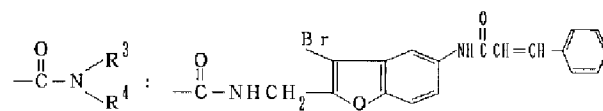
形態 : 遊離

【1007】

【表147】

実施例 268

構造



結晶形 : 白色粉末状

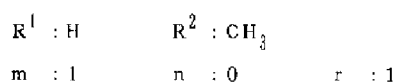
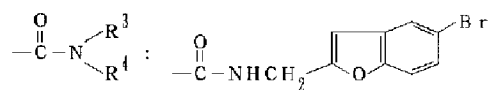
再結晶溶媒 : アセトニトリル

融点 : 235-236℃ (分解)

形態 : 遊離

実施例 269

構造



結晶形 : 無色針状

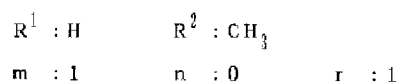
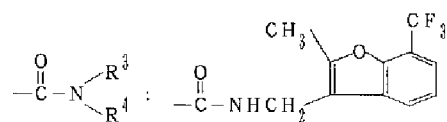
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 143-147℃

形態 : 遊離

実施例 270

構造



結晶形 : 無色針状

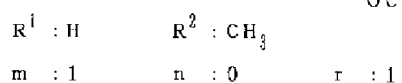
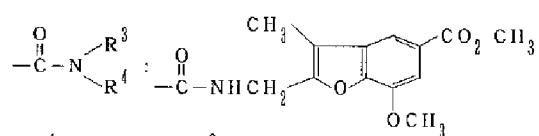
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 175-177℃

形態 : 遊離

実施例 271

構造



結晶形 : 白色粉末状

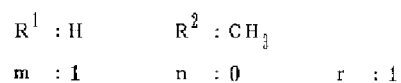
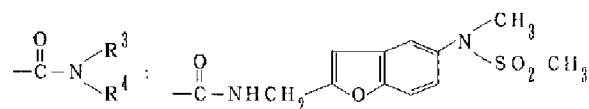
再結晶溶媒 : アセトニトリル

融点 : 226-227℃

形態 : 遊離

実施例 272

構造



結晶形 : 淡黄色粒状

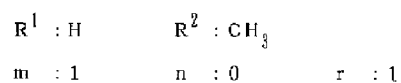
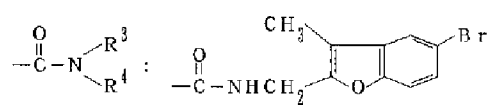
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 139-144℃

形態 : 遊離

実施例 273

構造



結晶形 : 黄色粒状

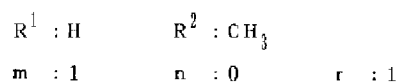
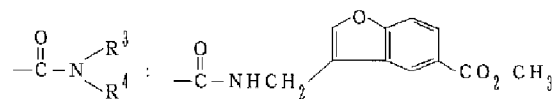
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 184-187℃

形態 : 遊離

実施例 274

構造



結晶形 : 淡黄色針状

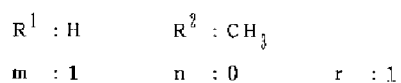
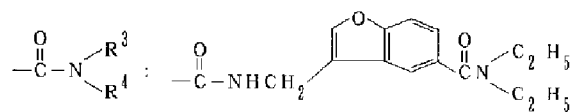
再結晶溶媒 : アセトニトリル

融点 : 183-185°C

形態 : 遊離

実施例 275

構造



結晶形 : 白色粉末状

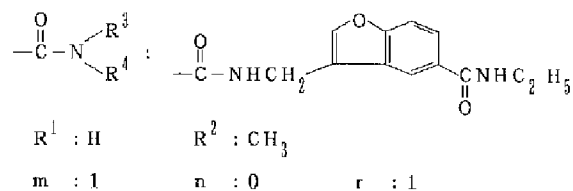
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 118-120°C

形態 : 遊離

実施例 276

構造



結晶形 : 無色針状

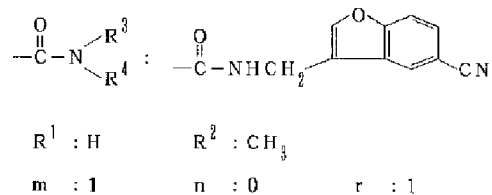
再結晶溶媒 : アセトニトリル

融点 : 217-218℃

形態 : 遊離

実施例 277

構造



結晶形 : 無色針状

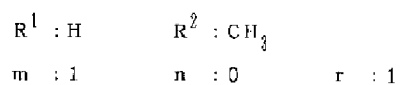
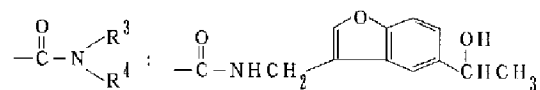
再結晶溶媒 : アセトニトリル

融点 : 213-214℃

形態 : 遊離

実施例 278

構造



結晶形 : 無色プリズム状

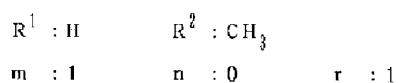
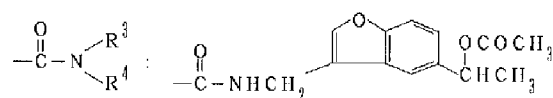
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 138-140℃

形態 : 遊離

実施例 279

構造



結晶形 : 無色針状

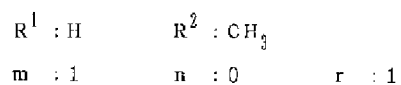
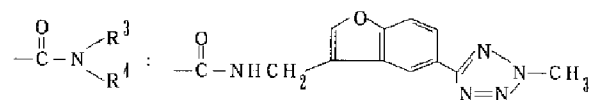
再結晶溶媒 : n-ヘキサノール酢酸エチル

融点 : 121-122℃

形態 : 遊離

実施例 280

構造



結晶形 : 無色針状

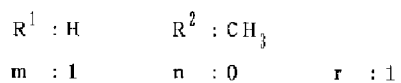
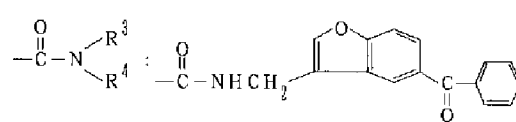
再結晶溶媒 : アセトニトリル

融点 : 247-248℃

形態 : 遊離

実施例 281

構造



結晶形 : 淡黄色粒状

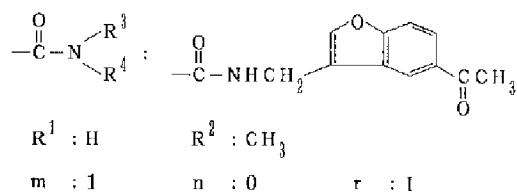
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 178-180℃

形態 : 遊離

実施例 282

構造



結 晶 形 : 無色粒状

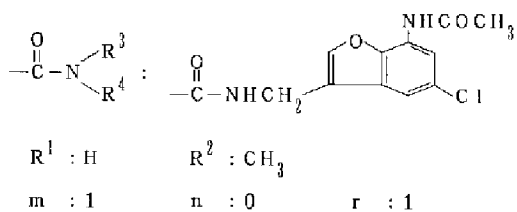
再結晶溶媒 : n-ヘキサン-酢酸エチル

融 点 : 190-191°C

形 態 : 遊 離

実施例 283

構造



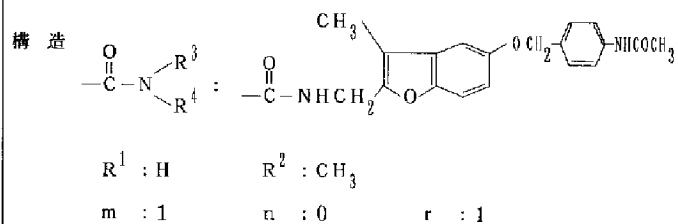
結 晶 形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : 酢酸エチル

融 点 : 238-240°C (分解)

形 態 : 遊 離

実施例 284



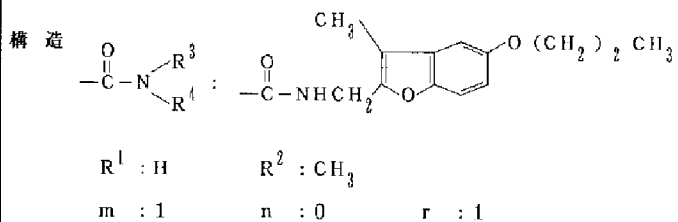
結晶形 : 無色針状

再結晶溶媒 : アセトニトリル

融点 : 221-222℃

形態 : 遊離

実施例 285



結晶形 : 無色針状

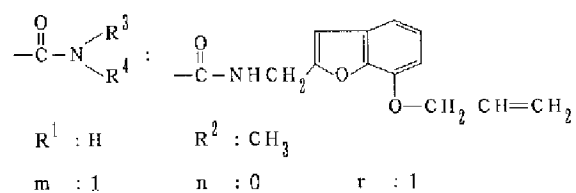
再結晶溶媒 : n-ヘキサン-酢酸エチル

融点 : 137-138℃

形態 : 遊離

実施例 286

構造



結晶形 : 無色針状

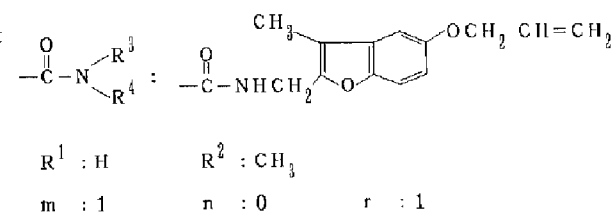
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 144-145℃

形態 : 遊離

実施例 287

構造



結晶形 : 黄色針状

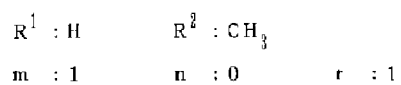
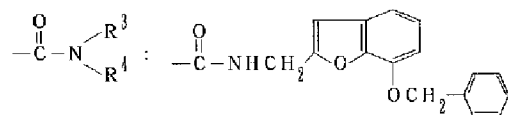
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 70-73℃

形態 : 遊離

実施例 288

構造



結晶形 : 無色針状

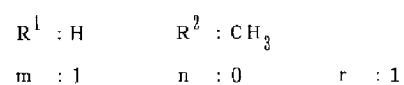
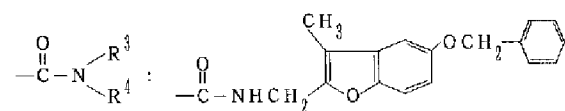
再結晶溶媒 : アセトニトリル

融点 : 189-190℃

形態 : 遊離

実施例 289

構造



結晶形 : 無色針状

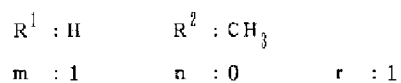
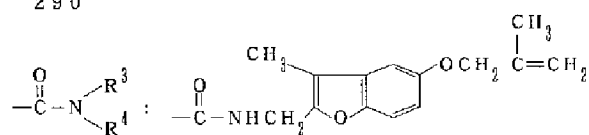
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 145-147℃

形態 : 遊離

実施例 290

構造



結晶形 : 無色針状

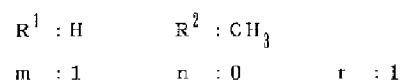
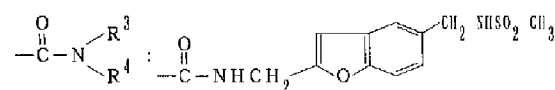
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 134-135℃

形態 : 遊離

実施例 291

構造



結晶形 : 無色粒状

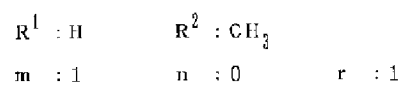
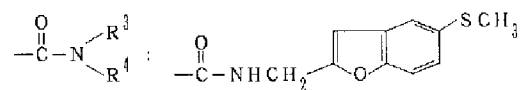
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 174-176℃

形態 : 遊離

実施例 292

構造



結晶形 : 無色針状

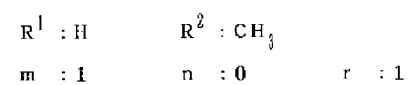
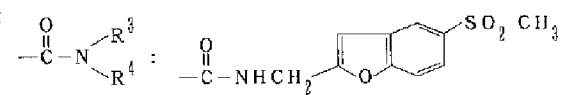
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 160-162°C

形態 : 遊離

実施例 293

構造



結晶形 : 無色針状

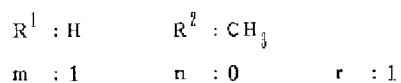
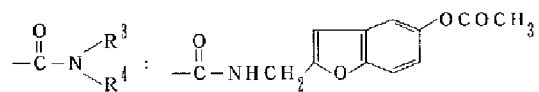
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 196-197°C

形態 : 遊離

実施例 294

構造



結晶形 : 無色針状

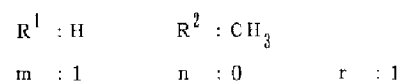
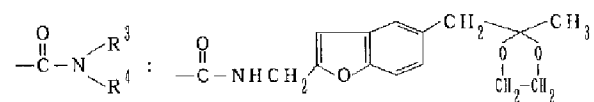
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 156-160°C

形態 : 遊離

実施例 295

構造



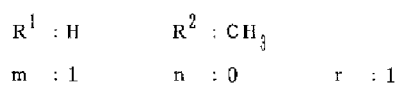
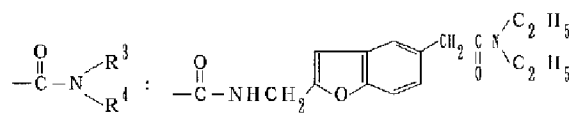
結晶形 : 白色粉末状

融点 : 129-131°C

形態 : 遊離

実施例 298

構造



結晶形 : 無色粒状

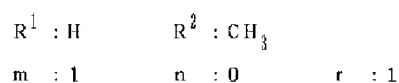
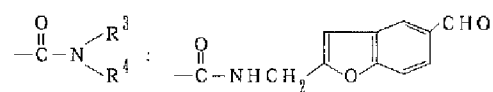
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 145-146℃

形態 : 遊離

実施例 299

構造



結晶形 : 淡黄色針状

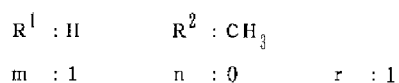
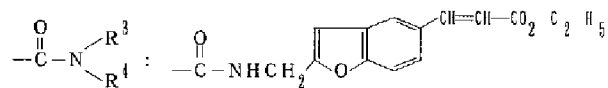
再結晶溶媒 : アセトニトリル

融点 : 184-186℃

形態 : 遊離

実施例 300

構造



結晶形 : 無色針状

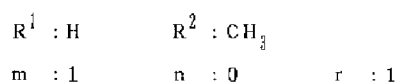
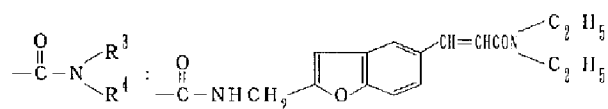
再結晶溶媒 : アセトニトリル

融点 : 162-163℃

形態 : 遊離

実施例 301

構造



結晶形 : 無色針状

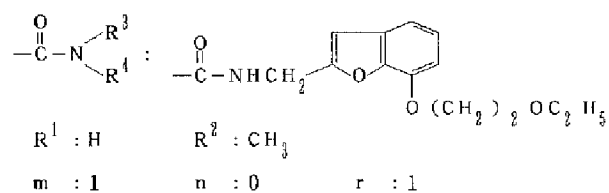
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 179-180℃

形態 : 遊離

実施例 302

構造



結晶形 : 淡褐色粒状

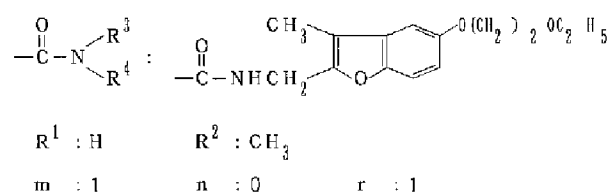
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 120-122℃

形態 : 遊離

実施例 303

構造



結晶形 : 淡黄色粒状

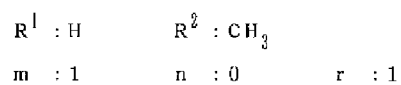
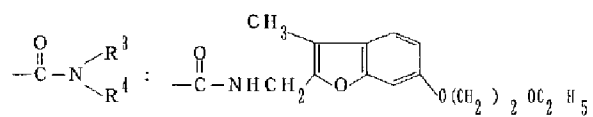
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 103-105℃

形態 : 遊離

実施例 304

構造



結晶形 : 淡黄色針状

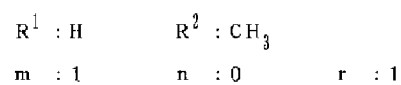
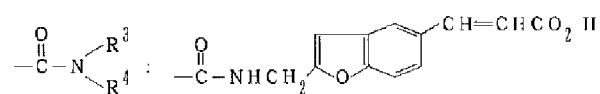
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 123-125℃

形態 : 遊離

実施例 305

構造

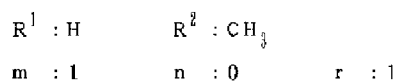
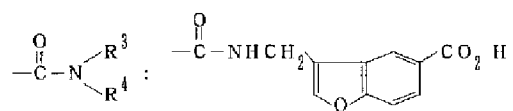


結晶形 : 淡黄色粉末状

形態 : 遊離

実施例 306

構造

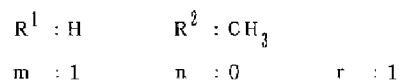
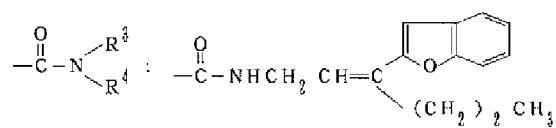


結晶形 : 白色粉末状

形態 : 遊離

実施例 307

構造



結晶形 : 白色針状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 103-105°C

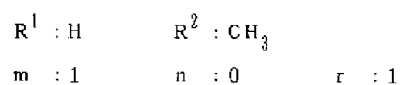
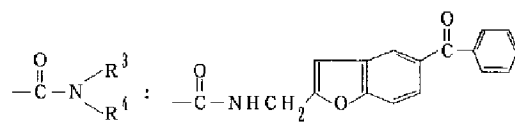
形態 : 遊離

【1027】

【表167】

実施例 308

構造



結晶形 : 黄色粉末状

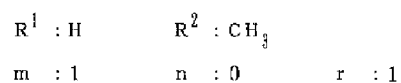
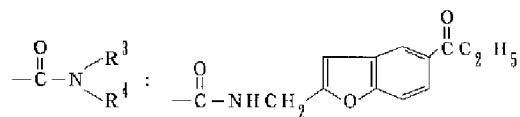
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 191-193℃

形態 : 遊離

実施例 309

構造



結晶形 : 白色粉末状

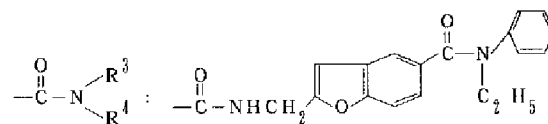
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融点 : 141.5-143℃

形態 : 遊離

実施例 310

構造

 $\text{R}^1 : \text{H}$ $\text{R}^2 : \text{CH}_3$ $m : 1$ $n : 0$ $r : 1$

結晶形 : 淡黄色プリズム状

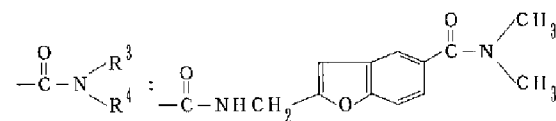
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融点 : 162-163℃

形態 : 遊離

実施例 311

構造

 $\text{R}^1 : \text{H}$ $\text{R}^2 : \text{CH}_3$ $m : 1$ $n : 0$ $r : 1$

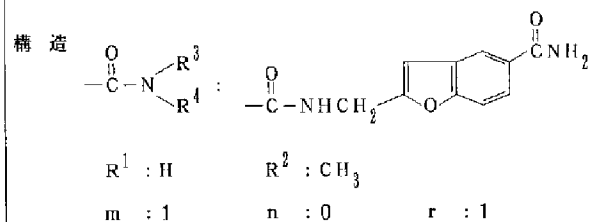
結晶形 : 淡黄色プリズム状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融点 : 178-179℃

形態 : 遊離

実施例 312



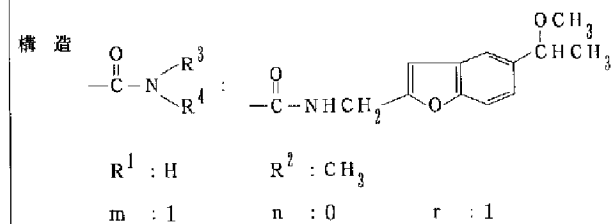
結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 230-231℃

形態 : 遊離

実施例 313



結晶形 : 白色粉末状

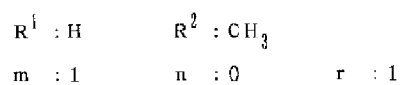
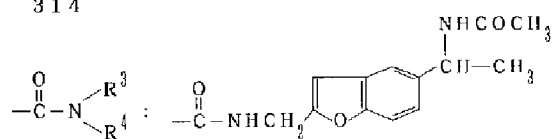
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 124.5-125℃

形態 : 遊離

実施例 314

構造



結晶形 : 白色粉末状

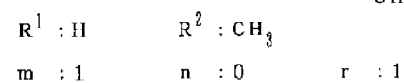
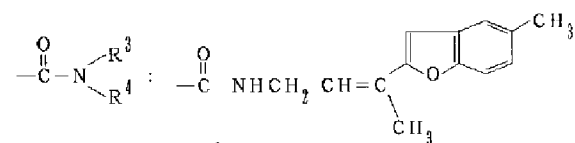
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-ジエチルエーテル

融点 : 198-200℃

形態 : 遊離

実施例 315

構造



結晶形 : 白色針状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-エタノール

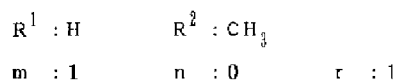
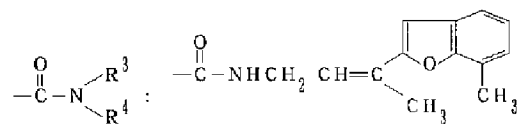
形態 : 遊離

【1031】

【表171】

実施例 316

構 造



結 晶 形 : 白色針状

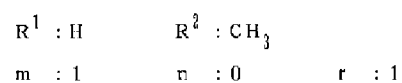
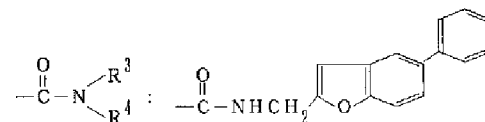
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-エタノール

融 点 : 193.5-196℃

形 態 : 遊 離

実施例 317

構 造



結 晶 形 : 白色鱗片状

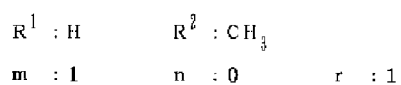
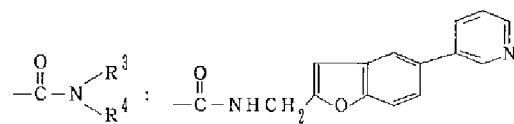
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融 点 : 203.5-207.5℃

形 態 : 遊 離

実施例 318

構造



結晶形 : 淡黄色粉末状

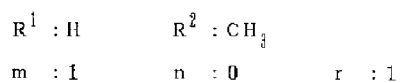
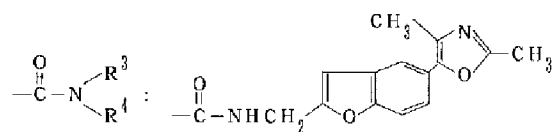
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融点 : 162-163℃

形態 : 遊離

実施例 319

構造



結晶形 : 淡黄色針状

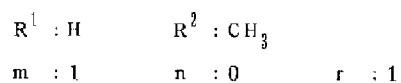
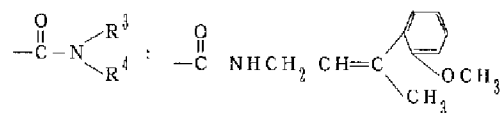
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 191-193℃

形態 : 遊離

実施例 320

構造



結晶形 : 白色針状

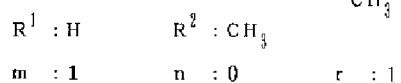
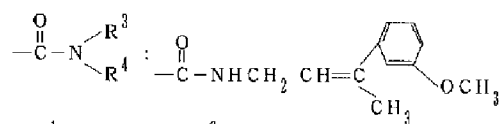
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融点 : 119-120℃

形態 : 遊離

実施例 321

構造



結晶形 : 淡黄色鱗片状

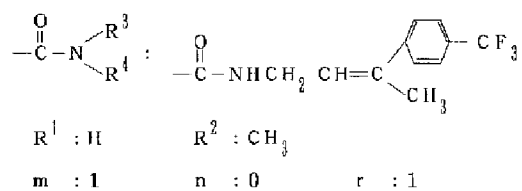
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-ジエチルエーテル

融点 : 86-88℃

形態 : 遊離

実施例 322

構造



結 晶 形 : 白色鱗片状

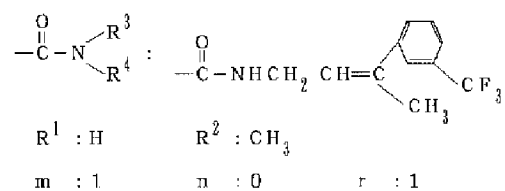
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融 点 : 140-142℃

形 態 : 遊 離

実施例 323

構造



結 晶 形 : 白色針状

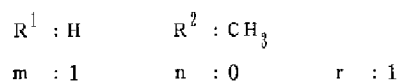
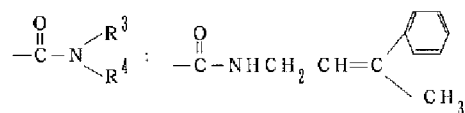
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融 点 : 115-117℃

形 態 : 遊 離

実施例 324

構造



結晶形 : 白色針状

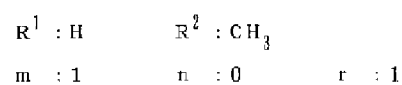
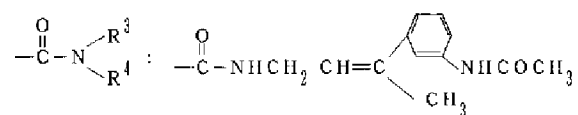
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融点 : 129-133℃

形態 : 遊離

実施例 325

構造



結晶形 : 白色針状

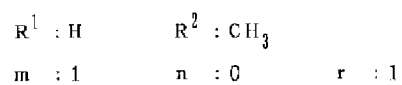
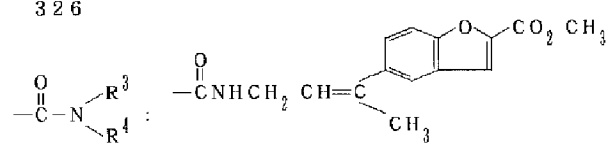
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-ジエチルエーテル

融点 : 177-179℃

形態 : 遊離

実施例 326

構造



結晶形 : 淡黄色粉末状

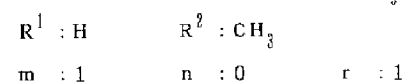
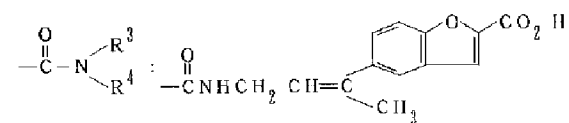
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融点 : 144-146℃

形態 : 遊離

実施例 327

構造

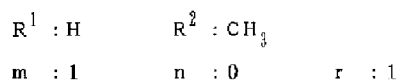
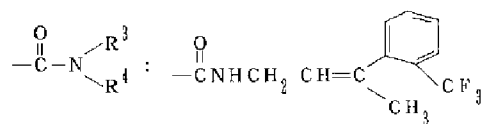


結晶形 : 黄色粉末状

形態 : 遊離

実施例 330

構造



結晶形 : 白色針状

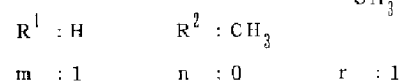
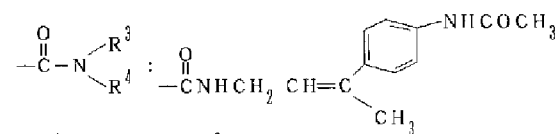
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融点 : 173-175℃

形態 : 遊離

実施例 331

構造



結晶形 : 淡黄色粉末状

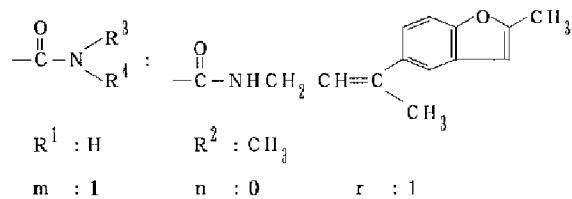
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融点 : 193-196℃

形態 : 遊離

実施例 332

構造



結晶形 : 白色針状

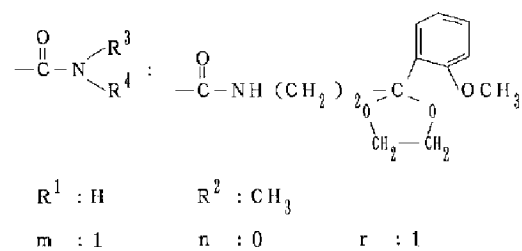
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融点 : 100-101℃

形態 : 遊離

実施例 333

構造



結晶形 : 白色針状

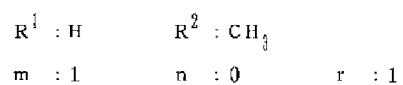
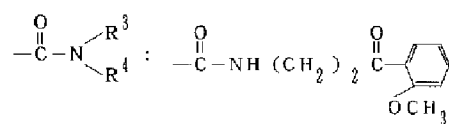
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融点 : 151-152℃

形態 : 遊離

実施例 334

構造



結晶形 : 白色針状

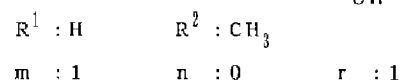
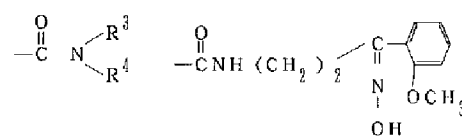
再結晶溶媒 : 酢酸エチル

融点 : 141-142℃

形態 : 遊離

実施例 335

構造

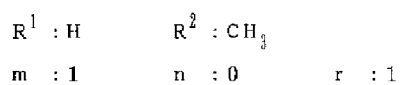
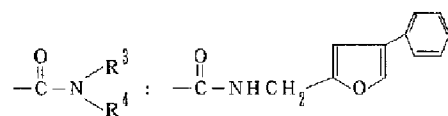


結晶形 : 白色不定形

形態 : 遊離

実施例 336

構造



結晶形 : 白色針状

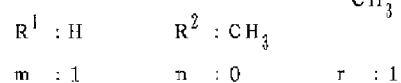
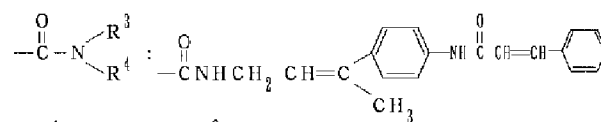
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融点 : 143.5-145℃

形態 : 遊離

実施例 337

構造



結晶形 : 淡黄色粉末状

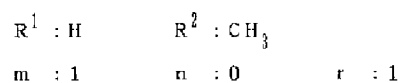
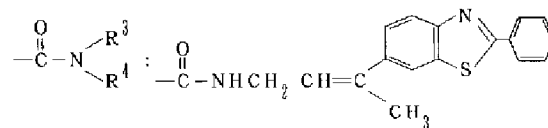
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融点 : 217-219℃

形態 : 遊離

実施例 338

構 造



結 晶 形 : 淡褐色粉末状

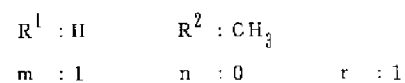
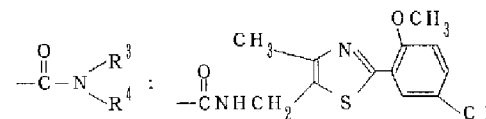
再結晶溶媒 : エタノール

融 点 : 166-168℃

形 態 : 遊 離

実施例 339

構 造



結 晶 形 : 黄色粉末状

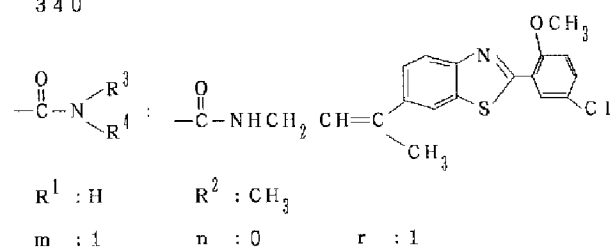
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融 点 : 223-228℃

形 態 : 遊 離

実施例 340

構造



結晶形 : 黄色粉末状

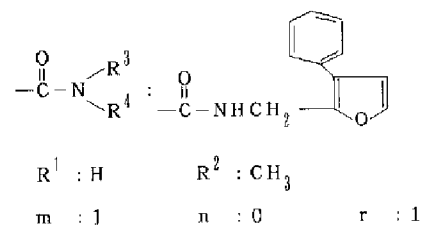
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-ジエチルエーテル

融点 : 228-230℃

形態 : 遊離

実施例 341

構造



結晶形 : 白色粉末状

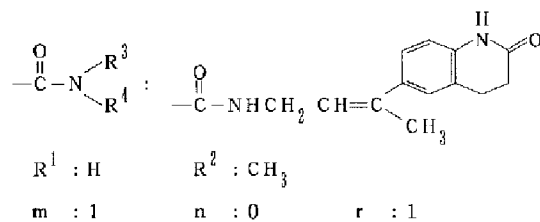
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融点 : 150-151℃

形態 : 遊離

実施例 342

構造



結晶形 : 白色粉末状

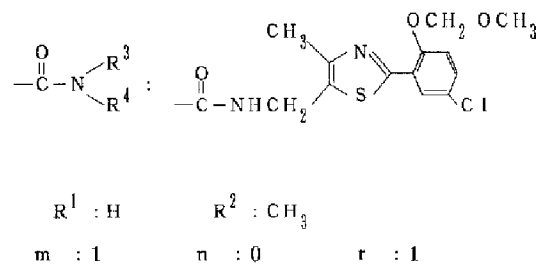
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 237-239℃

形態 : 遊離

実施例 343

構造



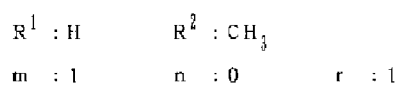
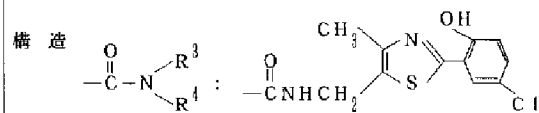
結晶形 : 無色針状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融点 : 180-205℃

形態 : 遊離

実施例 344



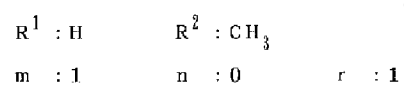
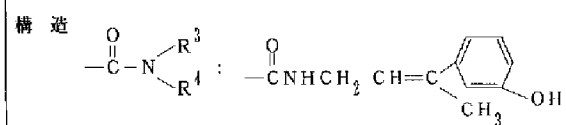
結 晶 形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : メタノール-ジクロロメタン-n-ヘキサン

融 点 : 240-243℃

形 態 : 遊 離

実施例 345



結 晶 形 : 白色鱗片状

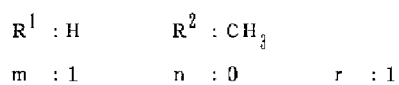
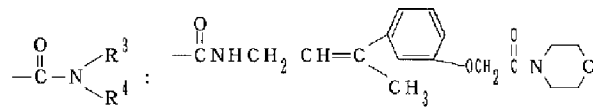
再結晶溶媒 : メタノール-ジクロロメタン-n-ヘキサン

融 点 : 182.5-186℃

形 態 : 遊 離

実施例 346

構造

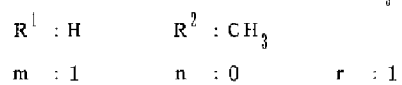
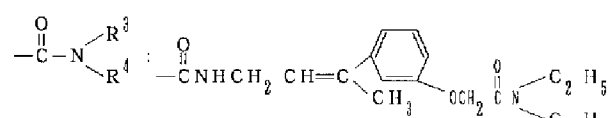


結晶形 : 淡黄色不定形

形態 : 遊離

実施例 347

構造



結晶形 : 白色不定形

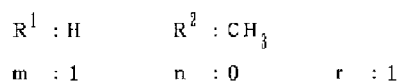
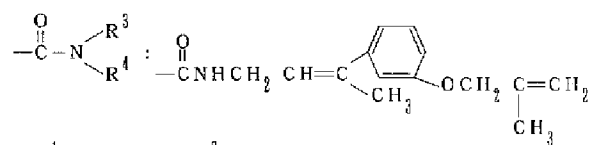
形態 : 遊離

【1047】

【表187】

実施例 348

構造

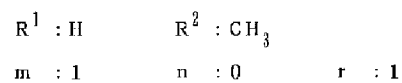
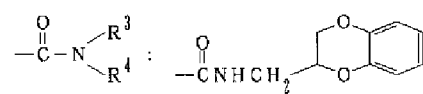


結晶形 : 淡黄色油状

形態 : 遊離

実施例 349

構造



結晶形 : 白色鱗片状

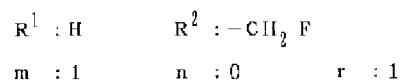
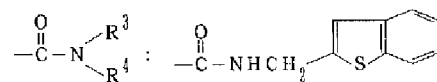
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融点 : 178.5-180℃

形態 : 遊離

実施例 350

構造



結晶形 : 淡黄色針状

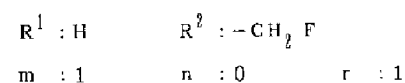
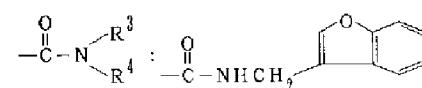
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融点 : 153-155℃

形態 : 遊離

実施例 351

構造



結晶形 : 白色粉末状

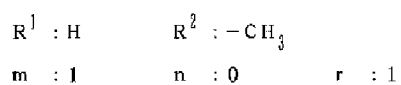
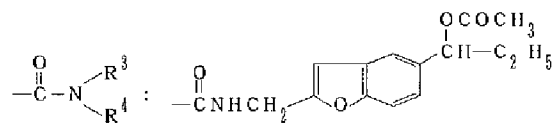
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融点 : 126-131℃

形態 : 遊離

実施例 354

構造

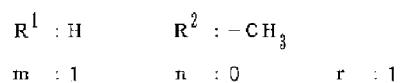
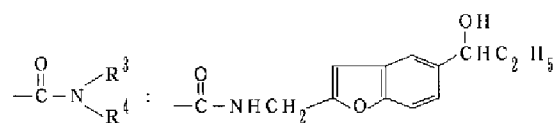


結晶形 : 淡黄色不定形

形態 : 遊離

実施例 355

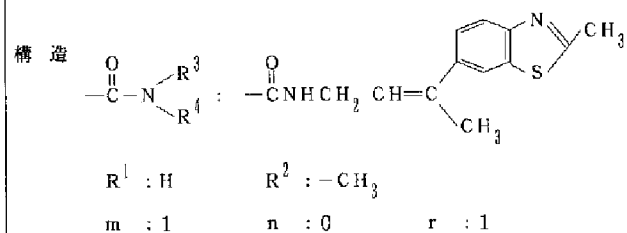
構造



結晶形 : 黄色不定形

形態 : 遊離

実施例 356



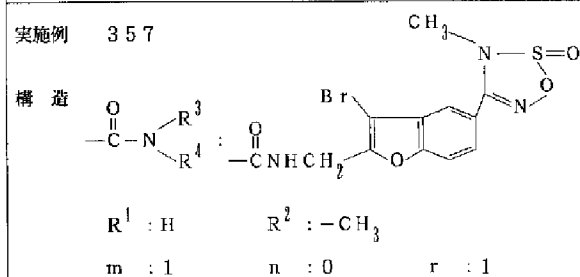
結晶形 : 淡黄色針状

再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 124.5-128℃

形態 : 遊離

実施例 357



結晶形 : 白色粉末状

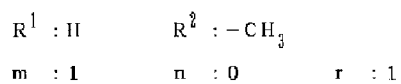
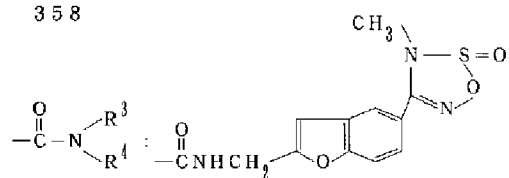
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融点 : 129-132℃

形態 : 遊離

実施例 358

構 造



結 晶 形 : 白色針状

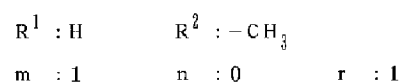
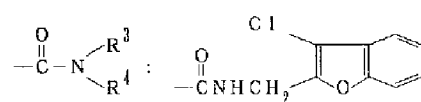
再結晶溶媒 : ジクロロメタン-n-ヘキサン

融 点 : 149-150°C

形 態 : 遊 離

実施例 359

構 造



結 晶 形 : 淡黄色粒状

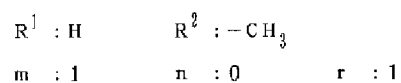
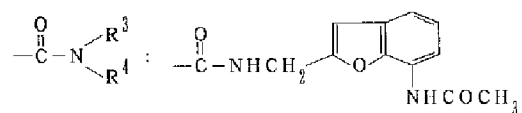
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融 点 : 151-153°C

形 態 : 遊 離

実施例 360

構造



結晶形 : 無色針状

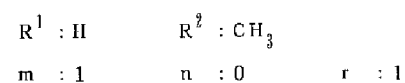
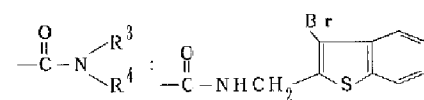
再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド-水

融点 : 237-238℃

形態 : 遊離

実施例 361

構造



結晶形 : 淡黄色鱗片状

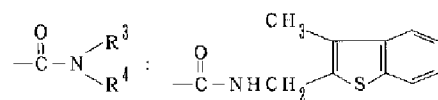
再結晶溶媒 : 酢酸エチル

融点 : 160-161℃

形態 : 遊離

実施例 362

構造

 $\text{R}^1 : \text{H}$ $\text{R}^2 : \text{CH}_3$ $m : 1$ $n : 0$ $r : 1$

結晶形 : 無色針状

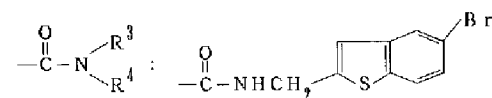
再結晶溶媒 : 酢酸エチル

融点 : 169-170°C

形態 : 遊離

実施例 363

構造

 $\text{R}^1 : \text{H}$ $\text{R}^2 : \text{CH}_3$ $m : 1$ $n : 0$ $r : 1$

結晶形 : 無色針状

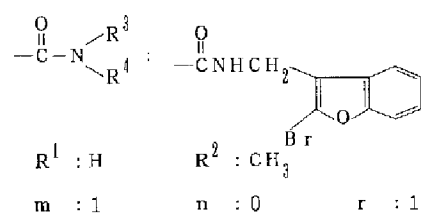
再結晶溶媒 : 酢酸エチル

融点 : 190-191°C

形態 : 遊離

実施例 364

構造



結晶形 : 無色針状

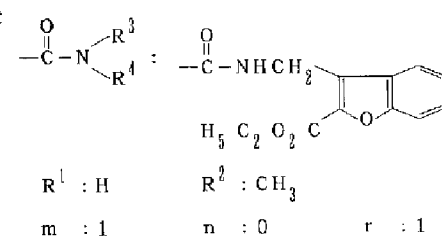
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 180-181℃

形態 : 遊離

実施例 365

構造



結晶形 : 無色粒状

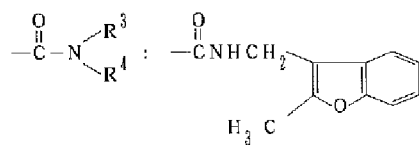
再結晶溶媒 : アセトン

融点 : 173-174℃

形態 : 遊離

实施例 366

構造


$$\begin{array}{lll} \text{R}^1 : \text{H} & \text{R}^2 : \text{CH}_3 & \\ \text{m} : 1 & \text{n} : 0 & \text{r} : 1 \end{array}$$

結 晶 形：無色針狀

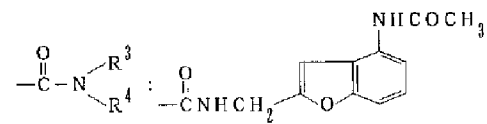
再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド—水

融 点 : $203-204^{\circ}\text{C}$

形態：遊離

实施例 367

構造


$$\begin{array}{lll} R^1 : H & R^2 : CH_3 & \\ m : 1 & n : 0 & r : 1 \end{array}$$

結 晶 形：淡黄色粒状

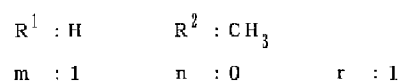
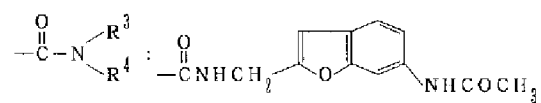
再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド—水

融 点 : 250-251℃

形態：遊離

実施例 368

構 造



結 晶 形 : 黄色針状

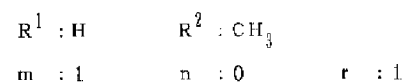
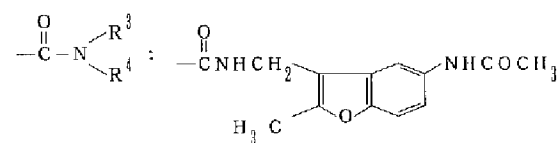
再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド-水

融 点 : 246-247℃

形 態 : 遊 離

実施例 369

構 造



結 晶 形 : 淡黄色針状

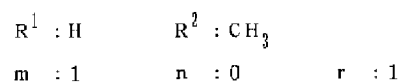
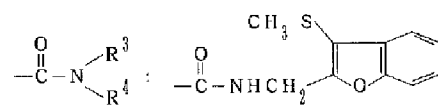
再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド-水

融 点 : 247-248℃

形 態 : 遊 離

実施例 370

構造



結晶形 : 無色針状

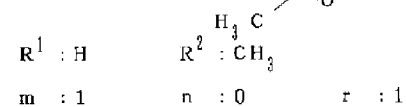
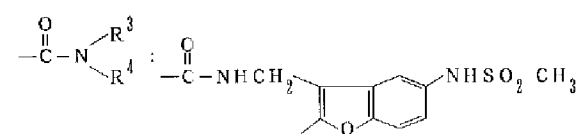
再結晶溶媒 : 酢酸エチル

融点 : 160-161℃

形態 : 遊離

実施例 371

構造



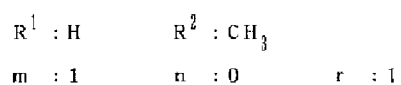
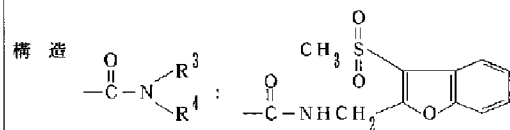
結晶形 : 淡褐色プリズム状

再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド-水

融点 : 214-215℃

形態 : 遊離

実施例 372



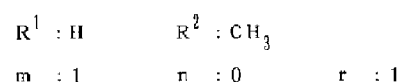
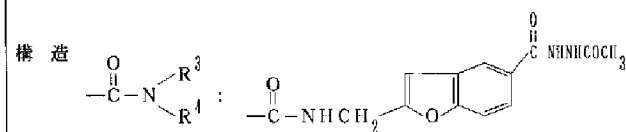
結 晶 形 : 無色プリズム状

再結晶溶媒 : アセトン

融 点 : 202-203℃

形 態 : 遊 離

実施例 373



結 晶 形 : 淡黄色粉末状

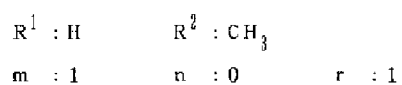
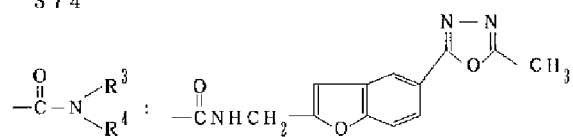
再結晶溶媒 : メタノール

融 点 : 254-255℃

形 態 : 遊 離

実施例 374

構造



結晶形 : 白色粉末状

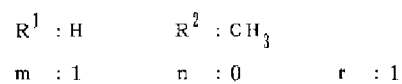
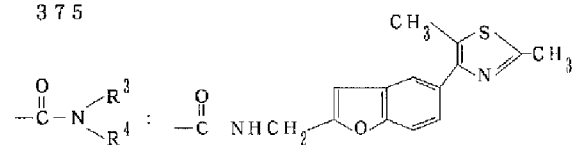
再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド-水

融点 : 201-203℃

形態 : 遊離

実施例 375

構造



結晶形 : 淡黄色粒状

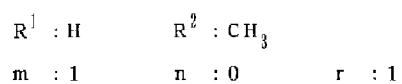
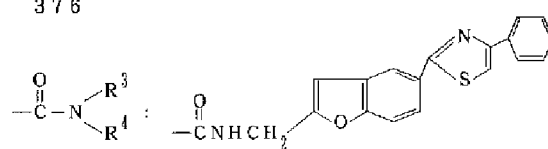
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 161-162℃

形態 : 遊離

実施例 376

構造



結晶形 : 黄色針状

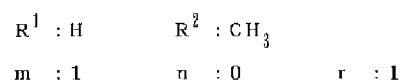
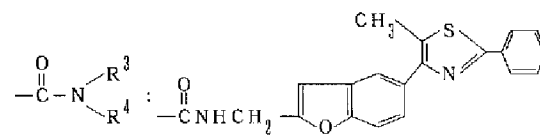
再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド-水

融点 : 197-198℃

形態 : 遊離

実施例 377

構造



結晶形 : 淡黄色粒状

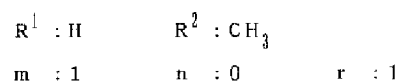
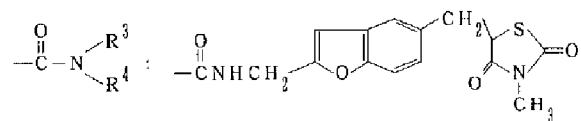
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 171-172℃

形態 : 遊離

実施例 380

構造



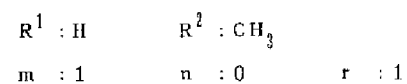
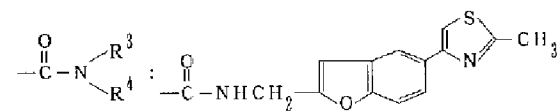
結晶形 : 淡黄色不定形

融点 : 97-100℃

形態 : 遊離

実施例 381

構造



結晶形 : 淡黄色粉末状

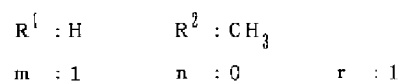
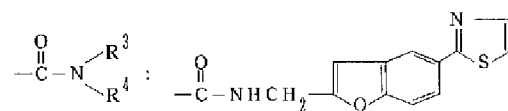
再結晶溶媒 : 酢酸エチル—n-ヘキサン

融点 : 148-149℃

形態 : 遊離

実施例 382

構造



結晶形 : 黄色粉末状

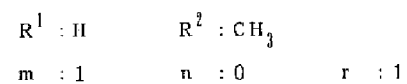
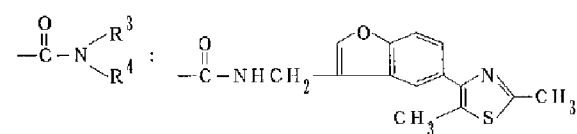
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 156-157℃

形態 : 遊離

実施例 383

構造



結晶形 : 黄色粒状

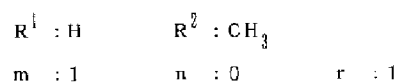
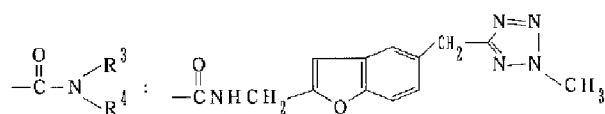
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 159-160℃

形態 : 遊離

実施例 384

構造



結晶形 : 無色針状

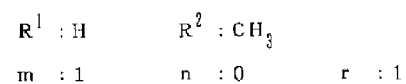
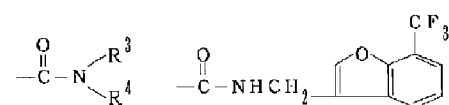
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 177-178℃

形態 : 遊離

実施例 385

構造



結晶形 : 無色針状

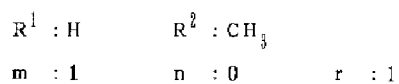
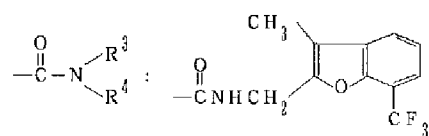
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 181-182℃

形態 : 遊離

実施例 386

構造



結晶形 : 白色粉末状

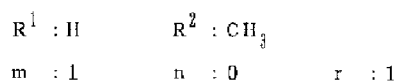
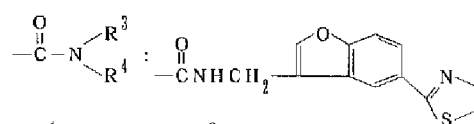
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 196-197℃

形態 : 遊離

実施例 387

構造



結晶形 : 無色針状

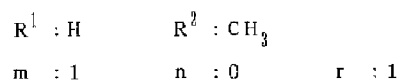
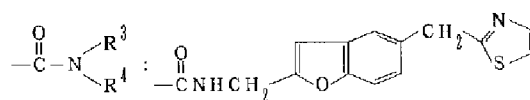
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 186-187℃

形態 : 遊離

実施例 388

構造



結晶形 : 淡黄色針状

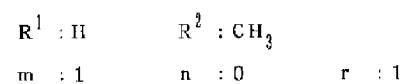
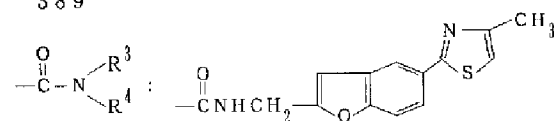
再結晶溶媒 : クロロホルム-n-ヘキサン

融点 : 175-176℃

形態 : 遊離

実施例 389

構造



結晶形 : 無色針状

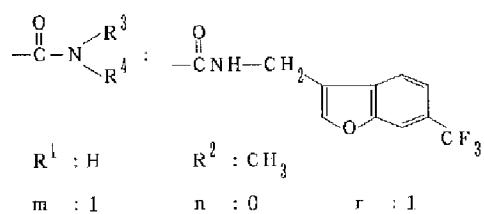
再結晶溶媒 : 酢酸エチル

融点 : 136-138℃

形態 : 遊離

実施例 390

構造



結晶形 : 白色粉末状

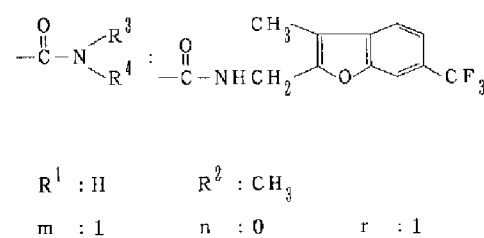
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 173-174℃

形態 : 遊離

実施例 391

構造



結晶形 : 無色鱗片状

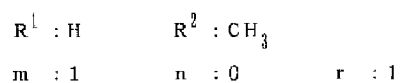
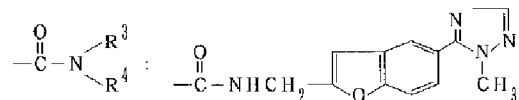
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 186-187℃

形態 : 遊離

実施例 392

構造



結晶形 : 淡黄色鱗片状

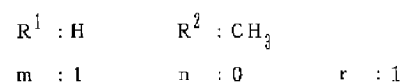
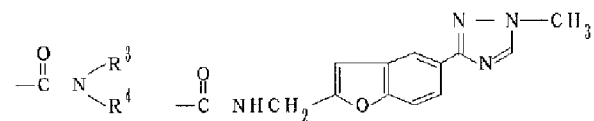
再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド-水

融点 : 197-198℃

形態 : 遊離

実施例 393

構造



結晶形 : 黄色鱗片状

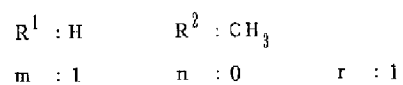
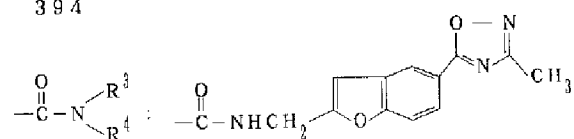
再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド-水

融点 : 230-231℃

形態 : 遊離

実施例 394

構造



結晶形 : 黄色針状

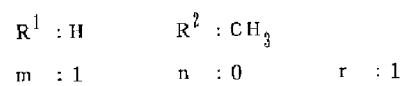
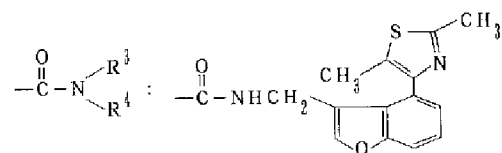
再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド-水

融点 : 225-226℃

形態 : 遊離

実施例 395

構造



結晶形 : 無色針状

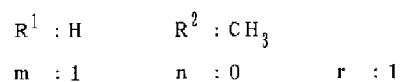
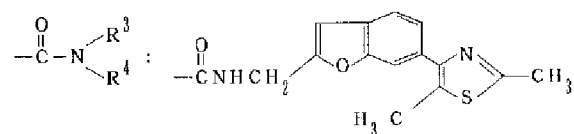
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 196-197℃

形態 : 遊離

実施例 396

構造



結晶形 : 淡黄色針状

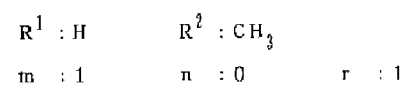
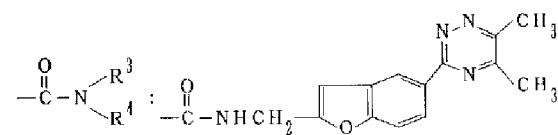
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-*n*-ヘキサン

融点 : 160-161℃

形態 : 遊離

実施例 397

構造



結晶形 : 淡黄色粒状

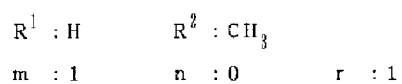
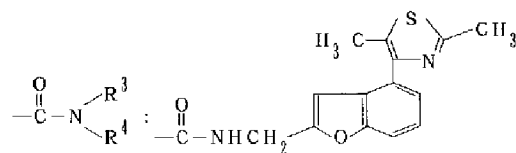
再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド-水

融点 : 218-220℃ (分解)

形態 : 遊離

実施例 398

構造



結晶形 : 無色針状

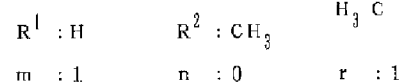
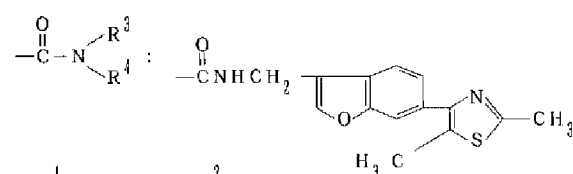
再結晶溶媒 : 酢酸エチル—n—ヘキサン

融点 : 168—169℃

形態 : 遊離

実施例 399

構造



結晶形 : 黄色プリズム状

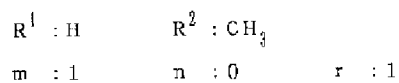
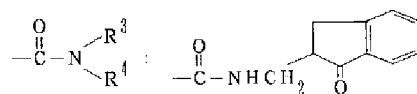
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 202—203℃

形態 : 遊離

実施例 400

構造



結晶形 : 無色針状

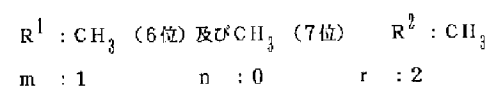
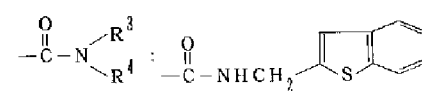
再結晶溶媒 : 酢酸エチル

融点 : 159-160℃

形態 : 遊離

実施例 401

構造



結晶形 : 褐色針状

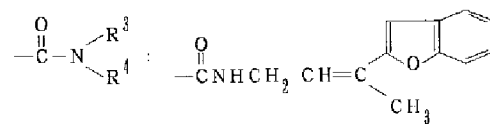
再結晶溶媒 : クロロホルム-n-ヘキサン

融点 : 207-208℃

形態 : 遊離

実施例 402

構造


 $\text{R}^1 : \text{CH}_3 \text{ (6位) 及び } \text{CH}_3 \text{ (7位)} \quad \text{R}^2 : \text{CH}_3$
 $m : 1 \quad n : 0 \quad r : 2$

結晶形 : 褐色鱗片状

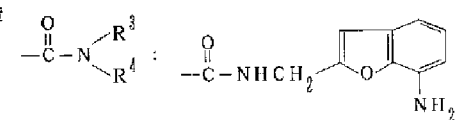
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 189-190℃

形態 : 遊離

実施例 403

構造

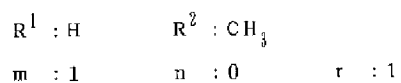
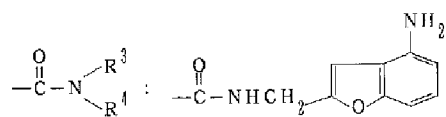

 $\text{R}^1 : \text{H} \quad \text{R}^2 : \text{CH}_3$
 $m : 1 \quad n : 0 \quad r : 1$

結晶形 : 黄色粉末状

形態 : 遊離

実施例 404

構造

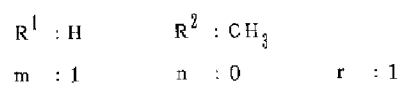
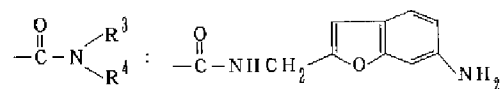


結晶形 : 黄色粉末状

形態 : 遊離

実施例 405

構造

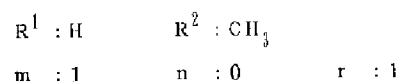
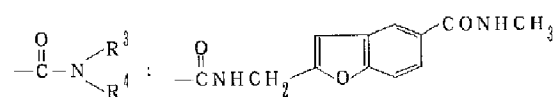


結晶形 : 橙色粉末状

形態 : 遊離

実施例 410

構造



結晶形 : 淡黄色プリズム状

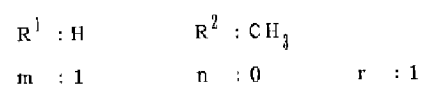
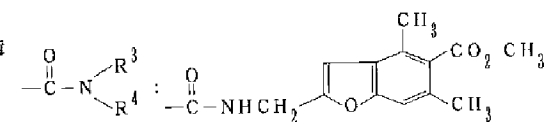
再結晶溶媒 : エタノール-ジメチルホルムアミド

融点 : 231-233℃

形態 : 遊離

実施例 411

構造



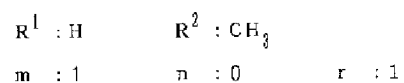
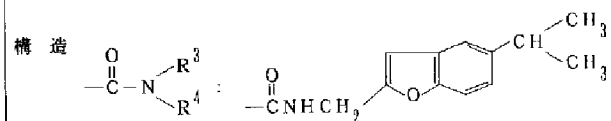
結晶形 : 淡黄色針状

再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 203-204℃

形態 : 遊離

実施例 412



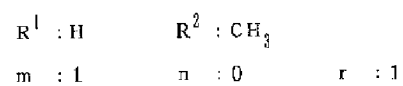
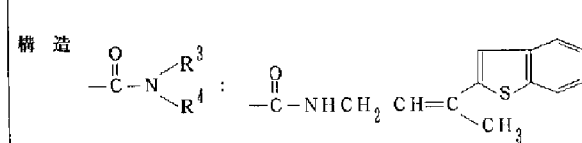
結晶形 : 淡黄色針状

再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 129-130℃

形態 : 遊離

実施例 413



結晶形 : 淡黄色プリズム状

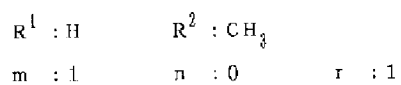
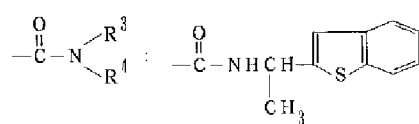
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 177-178℃

形態 : 遊離

実施例 414

構造



結晶形 : 黄色粉末状

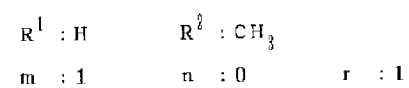
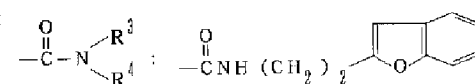
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 120-122℃

形態 : 遊離

実施例 415

構造



結晶形 : 無色針状

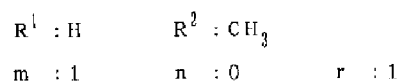
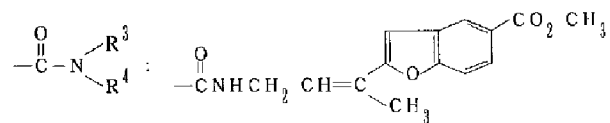
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 142-143℃

形態 : 遊離

実施例 416

構造



結晶形 : 淡黄色粉末状

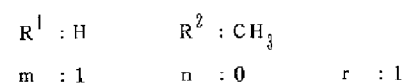
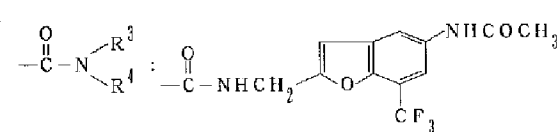
再結晶溶媒 : エタノール-ジメチルホルムアミド

融点 : 189-190°C

形態 : 遊離

実施例 417

構造



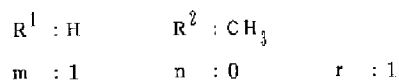
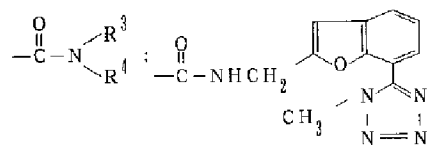
結晶形 : 黄色粉末状

再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド

融点 : 236-237°C

形態 : 遊離

実施例 418



結 晶 形 : 淡黄色プリズム状

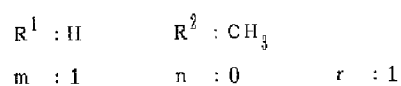
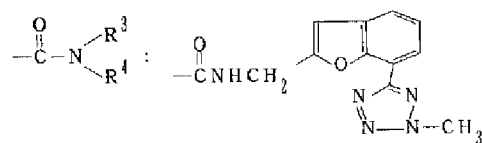
再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド

融 点 : 229-230℃

形 態 : 遊 離

実施例 419

構 造



結 晶 形 : 黄色粉末状

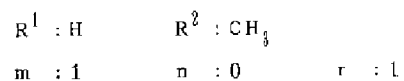
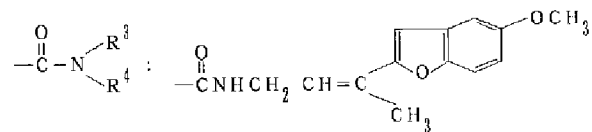
再結晶溶媒 : エタノール-ジメチルホルムアミド

融 点 : 233-234℃

形 態 : 遊 離

実施例 420

構造



結晶形 : 褐色板状

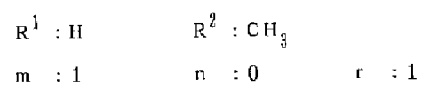
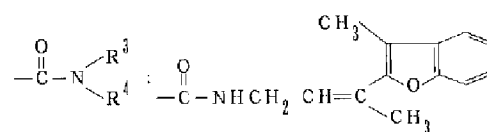
再結晶溶媒 : エタノール-ジメチルホルムアミド

融点 : 196-197°C

形態 : 遊離

実施例 421

構造



結晶形 : 黄色斜状

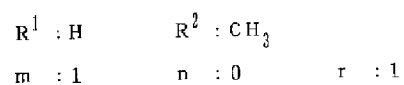
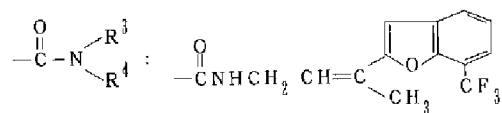
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 163-165°C

形態 : 遊離

実施例 422

構造



結晶形 : 無色針状

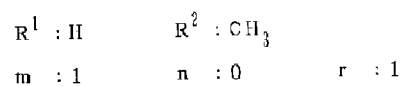
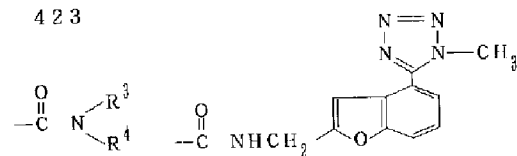
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 213-214℃

形態 : 遊離

実施例 423

構造



結晶形 : 黄色粉末状

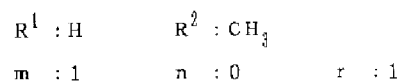
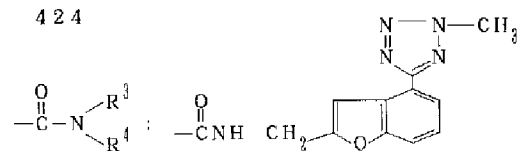
再結晶溶媒 : エタノール-ジメチルホルムアミド

融点 : 220-221℃

形態 : 遊離

実施例 424

構造



結晶形 : 黄色粉末状

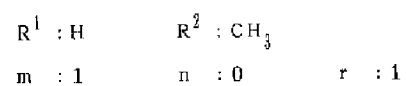
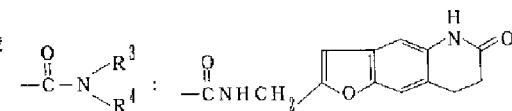
再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド

融点 : 214-215℃

形態 : 遊離

実施例 425

構造



結晶形 : 淡黄色粉末状

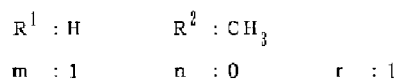
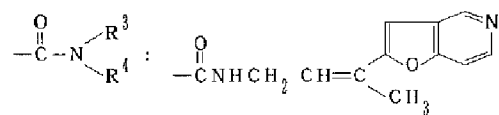
再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド

融点 : 244℃ (分解)

形態 : 遊離

実施例 426

構造



結晶形 : 淡黄色粉末状

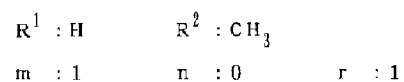
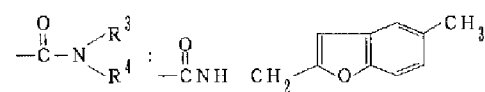
再結晶溶媒 : 酢酸エチル

融点 : 186-188℃

形態 : 遊離

実施例 427

構造



結晶形 : 淡黄色針状

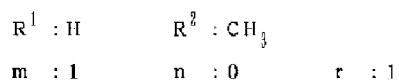
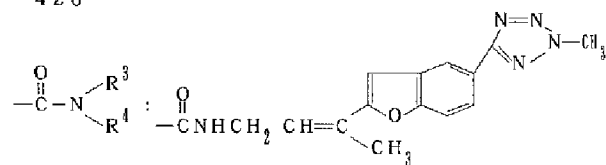
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 174-175℃

形態 : 遊離

実施例 428

構造



結晶形 : 黄色粉末状

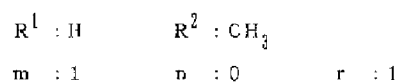
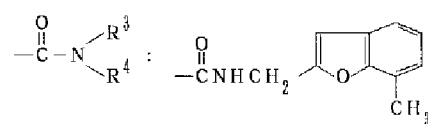
再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド

融点 : 202-203℃

形態 : 遊離

実施例 429

構造



結晶形 : 無色針状

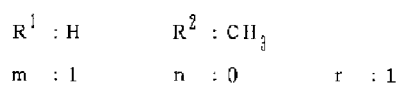
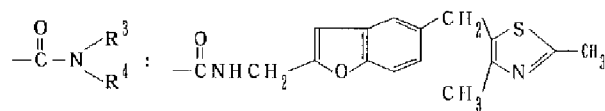
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 167-168℃

形態 : 遊離

実施例 430

構造



結晶形 : 白色粉末状

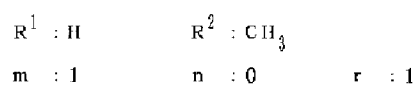
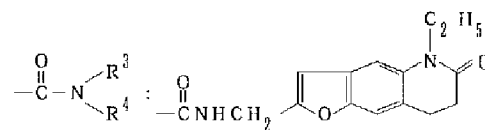
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 174-175℃

形態 : 遊離

実施例 431

構造



結晶形 : 淡黄色針状

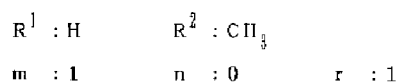
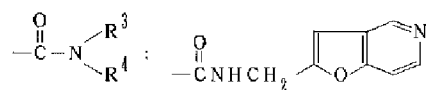
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 209-210℃

形態 : 遊離

実施例 432

構造



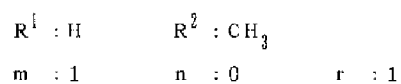
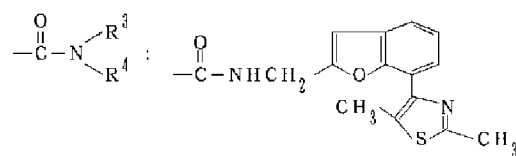
結晶形 : 淡黄色粉末状

融点 : 198-199°C

形態 : 遊離

実施例 433

構造



結晶形 : 淡黄色粉末状

再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド

融点 : 91-93°C

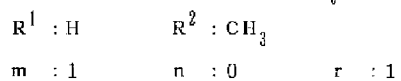
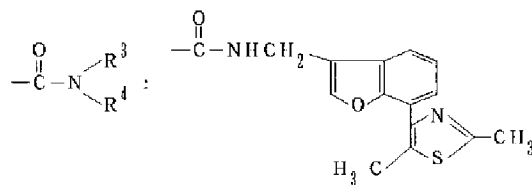
形態 : 遊離

【1090】

【表230】

実施例 434

構造



結晶形 : 白色粉末状

再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 212-213°C

形態 : 遊離

【1091】

【表231】

実施例 267

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 250MHz) δ ppm:

2.75 (6H, s), 3.08 (3H, s), 4.78 (2H, s),
 4.80 (2H, d, $J=8\text{Hz}$), 6.67 (1H, s), 7.14
 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.15-7.20 (5H, m),
 7.35 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.45 (1H, s), 7.75-
 7.90 (2H, m), 8.10 (1H, m), 8.45-8.60
 (2H, m)

実施例 305

 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO-d_6 , 250MHz) δ ppm:

2.69 (3H, s), 4.72 (2H, d, $J=6\text{Hz}$),
 6.51 (1H, d, $J=16\text{Hz}$), 6.88 (1H, s),
 7.55-7.75 (3H, m), 7.85-8.00 (3H, m),
 8.16 (1H, m), 8.50 (1H, m), 9.58 (1H, t,
 $J=6\text{Hz}$)

実施例 306

 $^1\text{H-NMR}$ (DMSO-d_6 , 250MHz) δ ppm:

2.65 (3H, s), 4.69 (2H, d, $J=6\text{Hz}$),
 7.68 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7.80-8.00 (3H, m),
 8.12 (1H, s), 8.15 (1H, m), 8.45 (1H, m),
 8.55 (1H, s), 9.49 (1H, t, $J=6\text{Hz}$),
 12.91 (1H, br)

実施例 315

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 250MHz) δ ppm:

2.17 (3H, s), 2.42 (3H, s), 3.11 (3H, s),
 4.39 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 6.47 (1H, t, $J=8\text{Hz}$),
 6.62 (1H, s), 7.07 (1H, d, $J=8\text{Hz}$),
 7.28 (1H, s), 7.30 (1H, d, $J=8\text{Hz}$),
 7.78-7.83 (2H, m), 8.05-8.15 (2H, m),
 8.60 (1H, m)

【1092】

【表232】

実施例 327

 ^1H -NMR (DMSO- d_6 , 250MHz) δ ppm:

1.99 (3H, s), 2.69 (3H, s), 4.18
 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 5.94 (1H, t, $J=7\text{Hz}$),
 7.59-7.70 (3H, m), 7.83 (1H, s),
 7.89-7.95 (2H, m), 8.18 (1H, m),
 8.48 (1H, m), 9.17 (1H, t, $J=7\text{Hz}$)

実施例 328

 ^1H -NMR (CDCl $_3$, 250MHz) δ ppm:

1.29 (6H, br), 2.25 (3H, s), 3.11 (3H, s),
 3.60 (4H, br), 4.34 (2H, t, $J=7\text{Hz}$),
 5.93 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 7.30 (1H, s),
 7.48 (2H, s), 7.68 (1H, s), 7.79-
 7.83 (2H, m), 8.05-8.15 (2H, m),
 8.62 (1H, m)

実施例 335

 ^1H -NMR (CDCl $_3$, 250MHz) δ ppm:

3.00 (3H, s), 3.17 (2H, t, $J=7\text{Hz}$),
 3.71 (2H, q, $J=7\text{Hz}$), 3.85 (3H, s),
 6.90 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 6.92 (1H, d, $J=8\text{Hz}$),
 7.27-7.36 (2H, m), 7.70-7.81 (2H, m),
 7.97 (1H, m), 8.27 (1H, br t, $J=7\text{Hz}$),
 8.55 (1H, m), 9.30 (1H, br),

実施例 343

 ^1H -NMR (CDCl $_3$, 250MHz) δ ppm:

2.57 (3H, s), 3.11 (3H, s), 3.51 (3H, s),
 4.85 (2H, d, $J=6\text{Hz}$), 5.34 (2H, s),
 7.17 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.29 (1H, dd,
 $J=8\text{Hz}$, 2.5Hz), 7.78-7.82 (2H, m),
 8.06 (1H, m), 8.28 (1H, br), 8.36
 (1H, d, $J=2.5\text{Hz}$), 8.60 (1H, m)

実施例 346

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 250MHz) δ ppm:

2. 17 (3H, s), 3. 09 (3H, s), 3. 63-3. 69 (8H, m), 4. 31 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 4. 71 (2H, s), 5. 92 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 6. 85 (1H, dd, $J=8\text{Hz}$, 2Hz), 7. 02 (1H, t, $J=2\text{Hz}$), 7. 08 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 26 (1H, t, $J=8\text{Hz}$), 7. 76-7. 83 (2H, m), 8. 05-8. 12 (2H, m), 8. 58 (1H, m)

実施例 347

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 250MHz) δ ppm:

1. 14 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1. 22 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 2. 17 (3H, s), 3. 10 (3H, s), 3. 40 (4H, q, $J=7\text{Hz}$), 4. 31 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 4. 69 (2H, s), 5. 92 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 6. 86 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 05 (1H, s), 7. 06 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 25 (1H, t, $J=8\text{Hz}$), 7. 79-7. 83 (2H, m), 8. 08-8. 12 (2H, m), 8. 60 (1H, m)

実施例 348

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 250MHz) δ ppm:

1. 83 (3H, s), 2. 18 (3H, s), 3. 10 (3H, s), 4. 31 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 4. 45 (2H, s), 4. 99 (1H, s), 5. 10 (1H, s), 5. 93 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 6. 84 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 00 (1H, s), 7. 03 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 24 (1H, t, $J=8\text{Hz}$), 7. 78-7. 82 (2H, m), 8. 07-8. 11 (2H, m), 8. 60 (1H, m)

実施例 353

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 250MHz) δ ppm:

2. 18 (3H, s), 3. 10 (3H, s), 3. 49 (3H, s), 4. 31 (2H, t, $J=7\text{Hz}$), 5. 19 (2H, s), 5. 93 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 6. 95 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 08 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 10 (1H, s), 7. 25 (1H, t, $J=8\text{Hz}$), 7. 77-7. 84 (2H, m), 8. 06-8. 11 (2H, m), 8. 60 (1H, m)

実施例 354

 ^1H -NMR (CDCl_3 , 250MHz) δ ppm:

0.87 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.78-2.05 (2H, m),
 2.06 (3H, s), 3.10 (3H, s), 4.82 (2H, d,
 $J=6\text{Hz}$), 5.72 (1H, t, $J=8\text{Hz}$), 6.72 (1H, s),
 7.26 (1H, dd, $J=8\text{Hz}$, 2Hz), 7.44 (1H, d, $J=$
 8Hz), 7.52 (1H, d, $J=2\text{Hz}$), 7.77-
 7.83 (2H, m), 8.08 (1H, m), 8.48 (1H, br),
 8.58 (1H, m)

実施例 355

 ^1H -NMR (CDCl_3 , 250MHz) δ ppm:

0.91 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1.82 (2H, m), 3.10
 (3H, s), 4.69 (1H, br), 4.82 (2H, d,
 $J=6\text{Hz}$), 6.71 (1H, s), 7.25 (1H, d, $J=$
 8Hz), 7.41 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.51 (1H, s),
 7.78-7.82 (2H, m), 8.07 (1H, m), 8.51
 (1H, br), 8.58 (1H, m)

実施例 357

 ^1H -NMR (CDCl_3 , 250MHz) δ ppm:

3.09 (3H, s), 3.41 (3H, s), 4.89 (2H, d,
 $J=7\text{Hz}$), 7.06 (1H, d, $J=2\text{Hz}$), 7.14 (1H,
 dd, $J=8\text{Hz}$, 2Hz), 7.43 (1H, d, $J=8\text{Hz}$),
 7.75-7.82 (2H, m), 8.07 (1H, m), 8.53-
 8.59 (2H, m).

実施例 358

 ^1H -NMR (CDCl_3 , 250MHz) δ ppm:

3.07 (3H, s), 3.35 (3H, s), 4.82 (2H, d,
 $J=7\text{Hz}$), 6.68 (1H, s), 7.03 (1H, dd, $J=$
 8Hz , 2Hz), 7.17 (1H, d, $J=2\text{Hz}$), 7.41
 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7.74-7.82 (2H, m), 8.06
 (1H, m), 8.52-8.57 (2H, m)

実施例 403

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 250MHz) δ ppm:

3. 10 (3H, s), 3. 73 (2H, br), 4. 82
 (2H, d, $J=6\text{Hz}$), 6. 64 (1H, d, $J=7\text{Hz}$),
 6. 69 (1H, s), 6. 9-7. 1 (2H, m), 7. 7-7. 9
 (2H, m), 8. 0-8. 1 (1H, m), 8. 44 (1H, br),
 8. 5-8. 6 (1H, m)

実施例 404

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 250MHz) δ ppm:

3. 11 (3H, s), 3. 91 (2H, brs), 4. 81
 (2H, d, $J=6\text{Hz}$), 6. 51 (1H, d, $J=8\text{Hz}$),
 6. 68 (1H, s), 6. 93 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 12
 (1H, dd, $J=8\text{Hz}$, 8Hz), 7. 7-7. 9 (2H, m),
 8. 0-8. 2 (1H, m), 8. 48 (1H, brs), 8. 5-
 8. 7 (1H, m)

実施例 405

 $^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, 250MHz) δ ppm:

2. 67 (3H, s), 4. 60 (2H, d, $J=6\text{Hz}$),
 5. 14 (1H, s), 6. 53 (1H, d, $J=8\text{Hz}$),
 6. 58 (1H, s), 6. 67 (1H, s), 7. 21 (1H, d,
 $J=8\text{Hz}$), 7. 8-8. 0 (2H, m), 8. 1-8. 2
 (1H, m), 8. 4-8. 5 (1H, m), 9. 40 (1H, br)

実施例 406

 $^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$, 250MHz) δ ppm:

2. 44 (3H, s), 2. 64 (3H, s), 4. 50
 (2H, d, $J=6\text{Hz}$), 4. 78 (2H, s), 6. 51
 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 6. 80 (1H, s), 7. 12
 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 8-8. 0 (2H, m),
 8. 1-8. 2 (1H, m), 8. 4-8. 5 (1H, m),
 9. 21 (1H, t, $J=6\text{Hz}$)

【1096】

【表236】

実施例 407

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 250MHz) δ ppm:

0. 20 (3H, s), 0. 22 (3H, s), 0. 95 (9H, s),
 2. 6-2. 8 (2H, m), 3. 09 (3H, s), 3. 1-
 3. 3 (1H, m), 3. 6-3. 8 (2H, m), 5. 07
 (1H, d, $J=6\text{Hz}$), 7. 2-7. 3 (4H, m), 7. 7-
 7. 9 (2H, m), 8. 0-8. 2 (2H, m), 8. 5-8. 7
 (1H, m)

実施例 408

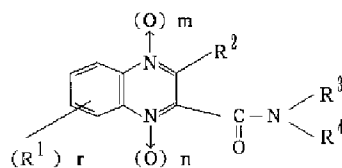
 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3 , 250MHz) δ ppm:

2. 6-2. 8 (1H, br), 2. 9-3. 1 (2H, m),
 3. 06 (3H, s), 3. 6-4. 0 (3H, m), 5. 15
 (1H, t, $J=5\text{Hz}$), 7. 1-7. 3 (3H, m), 7. 4-
 7. 5 (1H, m), 7. 7-7. 9 (2H, m), 8. 0-8. 1
 (1H, m), 8. 45 (1H, brs), 8. 5-8. 7 (1H, m)

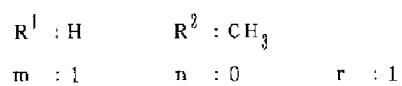
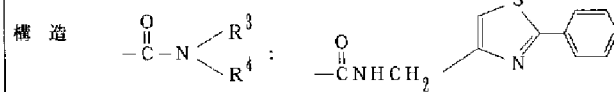
【1097】適当な出発原料を用い、前記実施例1、2 及び3と同様にして下記表237～表259に示す化合

物を得た。
【1098】

【表237】



実施例 435



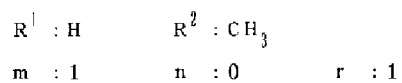
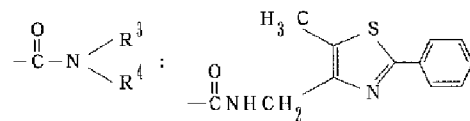
結 晶 形 : 無色プリズム状
 再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド
 融 点 : 237-238°C (分解)
 形 態 : 遊 離

【1099】

【表238】

実施例 436

構造



結晶形 : 淡黄色針状

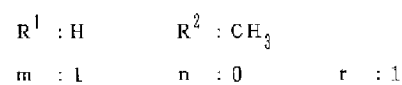
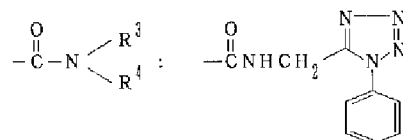
再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド-エタノール

融点 : 209-209.5℃

形態 : 遊離

実施例 437

構造



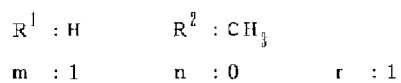
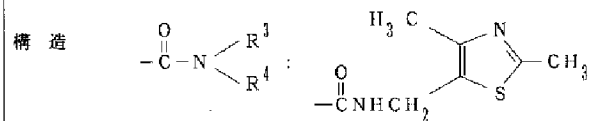
結晶形 : 無色針状

再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 198.5-199℃

形態 : 遊離

実施例 438



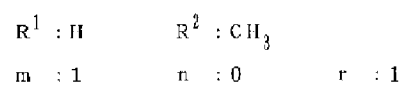
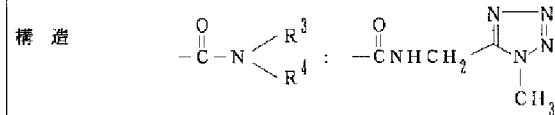
結晶形 : 無色針状

再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 193.5-194℃

形態 : 遊離

実施例 439



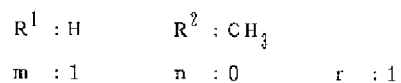
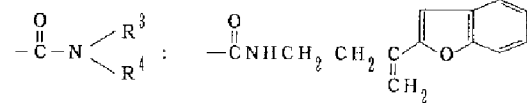
結晶形 : 白色粉末状

融点 : 211℃

形態 : 遊離

実施例 440

構 造



結 晶 形 : 黄色針状

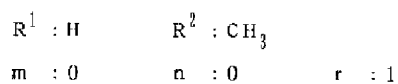
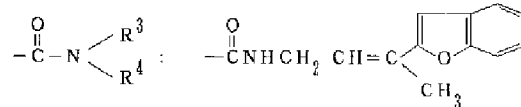
再結晶溶媒 : エタノール

融 点 : 137-138°C

形 態 : 遊 離

実施例 441

構 造



結 晶 形 : 無色針状

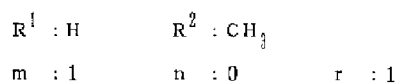
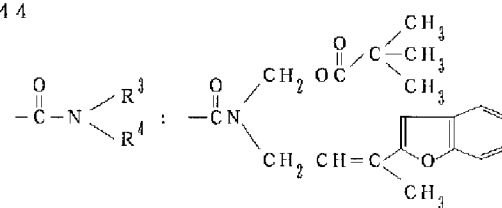
再結晶溶媒 : エタノール

融 点 : 155.5-156 (°C)

形 態 : 遊 離

実施例 444

構造



結晶形 : 淡黄色針状

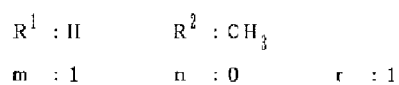
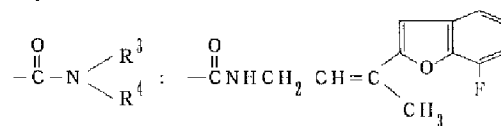
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル-n-ヘキサン

融点 : 127-129℃

形態 : 遊離

実施例 445

構造



結晶形 : 無色針状

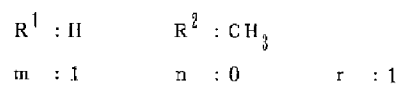
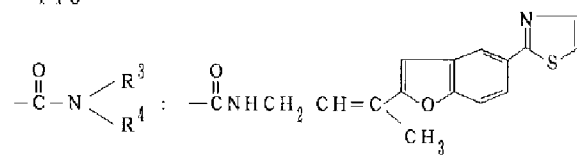
再結晶溶媒 : アセトニトリル

融点 : 212-213℃ (分解)

形態 : 遊離

実施例 446

構造



結晶形 : 淡黄色針状

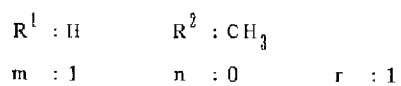
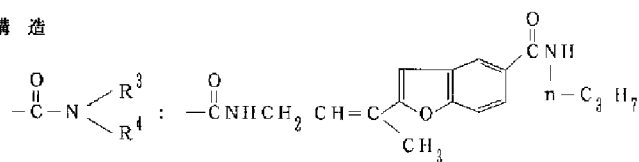
再結晶溶媒 : アセトニトリル

融点 : 197-198°C

形態 : 遊離

実施例 447

構造



結晶形 : 無色針状

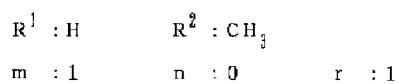
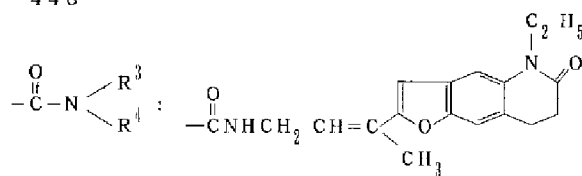
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 198-199°C

形態 : 遊離

実施例 448

構造



結晶形 : 淡黄色粒状

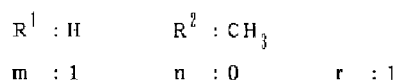
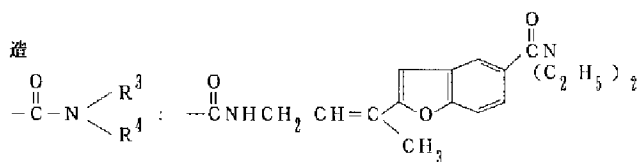
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 155-156°C

形態 : 遊離

実施例 449

構造



結晶形 : 淡黄色粉末状

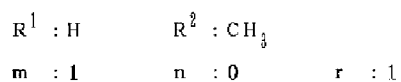
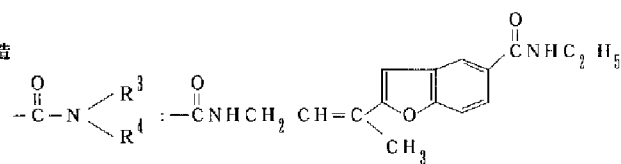
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 100-105°C

形態 : 遊離

実施例 450

構造



結晶形 : 無色針状

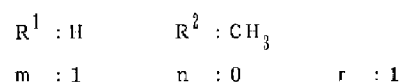
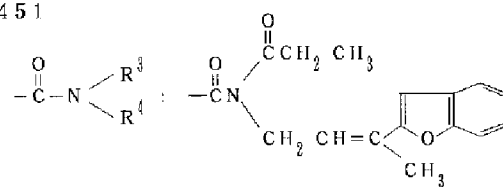
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 215-216°C (分解)

形態 : 遊離

実施例 451

構造



結晶形 : 無色粒状

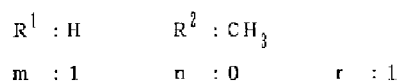
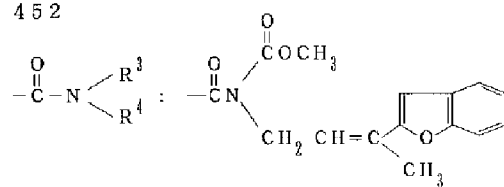
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 103-105°C

形態 : 遊離

実施例 452

構造



結晶形 : 黄色粒状

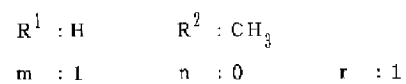
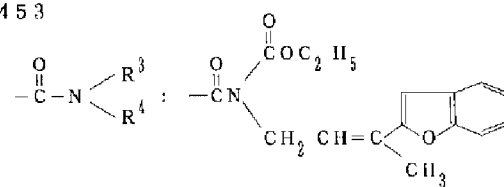
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 124-126℃

形態 : 遊離

実施例 453

構造



結晶形 : 淡黄色粒状

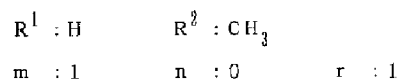
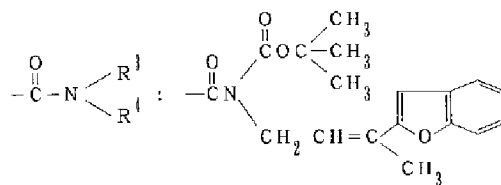
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 124-125℃

形態 : 遊離

実施例 454

構造



結晶形 : 白色粉末状

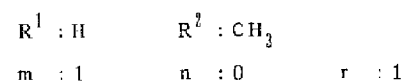
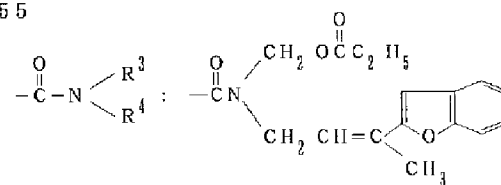
再結晶溶媒 : n-ヘキサンジエチルエーテル

融点 : 119-121℃

形態 : 遊離

実施例 455

構造



結晶形 : 淡黄色粒状

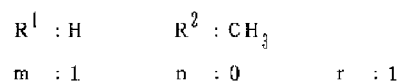
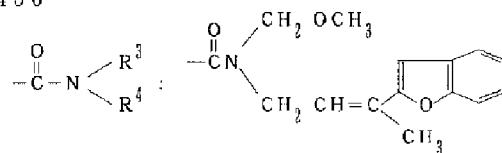
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 100-101℃

形態 : 遊離

実施例 456

構 造



結 晶 形 : 淡黄色粉末状

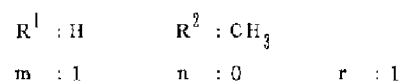
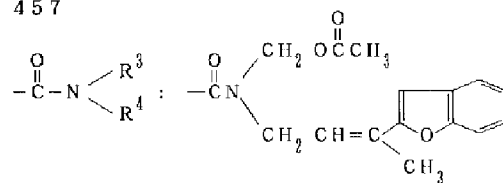
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融 点 : 122-124°C

形 態 : 遊 離

実施例 457

構 造



結 晶 形 : 白色粉末状

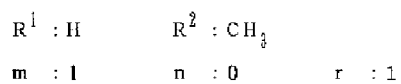
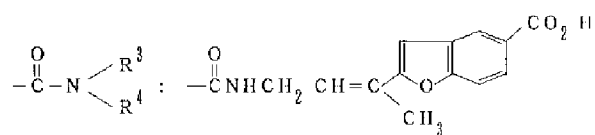
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融 点 : 107-109°C

形 態 : 遊 離

実施例 458

構造

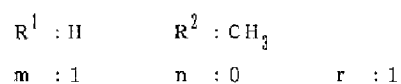
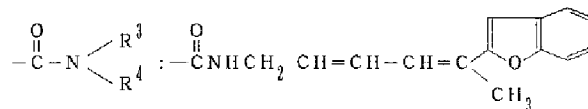


結晶形 : 赤色粉末状

形態 : 遊離

実施例 459

構造



結晶形 : 淡黄色針状

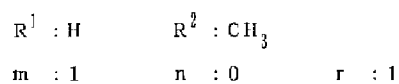
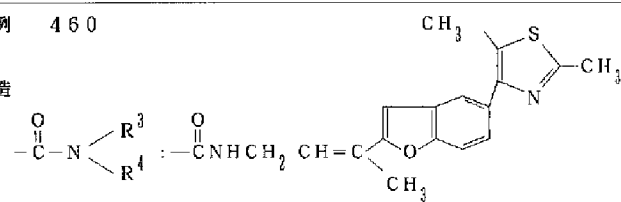
再結晶溶媒 : エタノール

融点 : 125-129℃

形態 : 遊離

実施例 460

構 造



結 晶 形 : 淡黄色針状

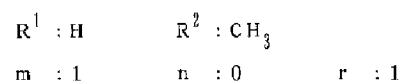
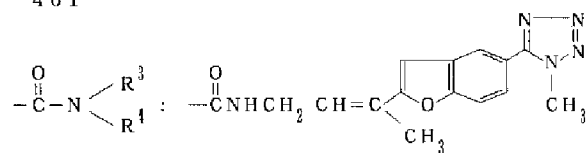
再結晶溶媒 : エタノール

融 点 : 154-157℃

形 態 : 遊 離

実施例 461

構 造



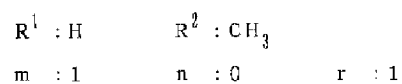
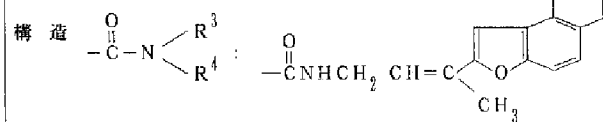
結 晶 形 : 淡黄色針状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-エタノール

融 点 : 206-208℃

形 態 : 遊 離

実施例 462



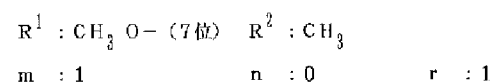
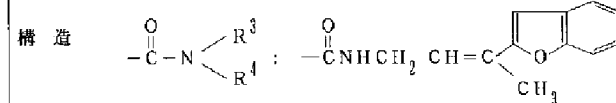
結晶形 : 淡黄色針状

再結晶溶媒 : ジクロロメタン-エタノール

融点 : 205-208℃

形態 : 遊離

実施例 463



結晶形 : 褐色粒状

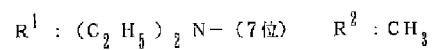
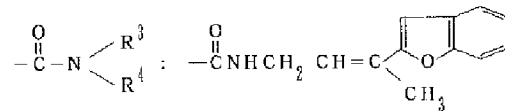
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 196-197℃

形態 : 遊離

実施例 464

構 造



結 晶 形 : 赤色針状

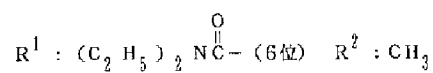
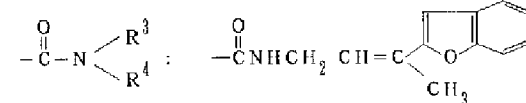
再結晶溶媒 : 酢酸エチル

融 点 : 202-204℃

形 態 : 遊 離

実施例 465

構 造



結 晶 形 : 淡黄色針状

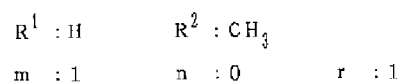
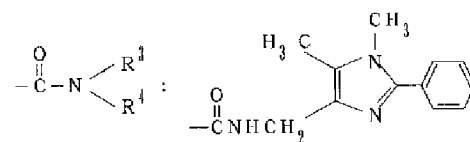
再結晶溶媒 : イソプロパノール

融 点 : 160-162℃

形 態 : 遊 離

実施例 466

構造



結晶形 : 無色針状

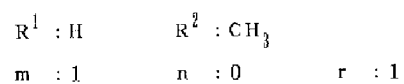
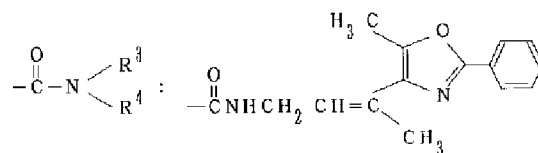
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-n-ヘキサン

融点 : 172-173℃

形態 : 遊離

実施例 467

構造



結晶形 : 黄色粒状

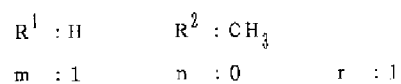
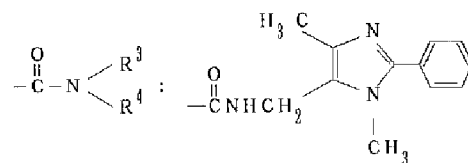
再結晶溶媒 : エタノール-水

融点 : 141-142℃

形態 : 遊離

実施例 468

構造



結晶形 : 黄色板状

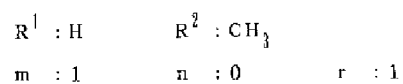
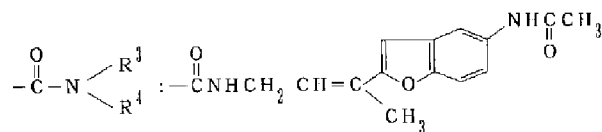
再結晶溶媒 : アセトン-n-ヘキサン

融点 : 148-150℃

形態 : 遊離

実施例 469

構造



結晶形 : 黄色粒状

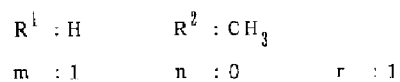
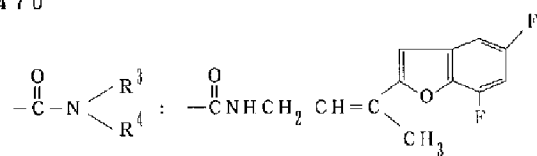
再結晶溶媒 : アセトニトリル

融点 : 221-223℃

形態 : 遊離

実施例 470

構造



結晶形 : 淡黄色針状

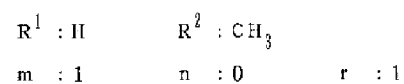
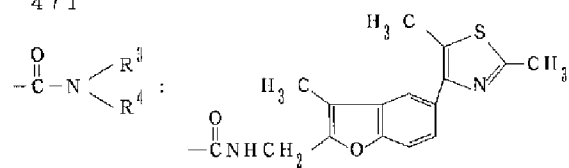
再結晶溶媒 : アセトニトリル

融点 : 207-208℃

形態 : 遊離

実施例 471

構造



結晶形 : 無色針状

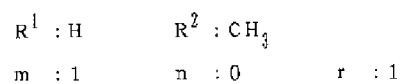
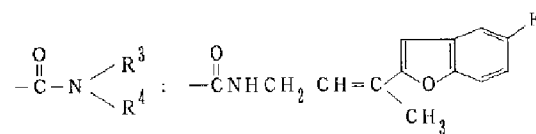
再結晶溶媒 : ジメチルホルムアミド-水

融点 : 205-206℃

形態 : 遊離

実施例 474

構造



結晶形 : 無色針状

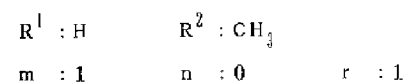
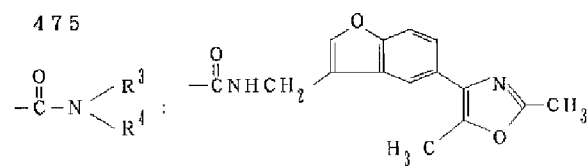
再結晶溶媒 : アセトニトリル

融点 : 188-189℃

形態 : 遊離

実施例 475

構造



結晶形 : 無色針状

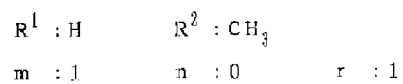
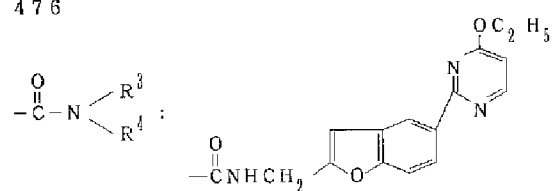
再結晶溶媒 : アセトニトリル-水

融点 : 174-175℃

形態 : 遊離

実施例 476

構造



結晶形 : 無色針状

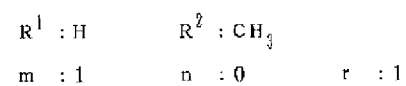
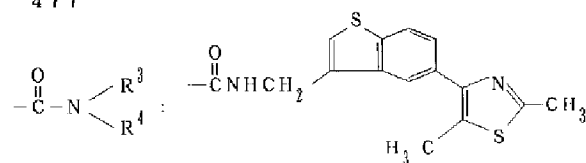
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-*n*-ヘキサン

融点 : 187-188℃

形態 : 遊離

実施例 477

構造



結晶形 : 無色針状

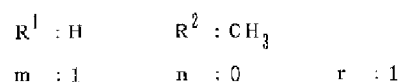
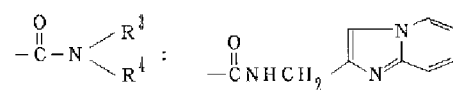
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-*n*-ヘキサン

融点 : 183-184℃

形態 : 遊離

実施例 478

構造



結晶形 : 黄色針状

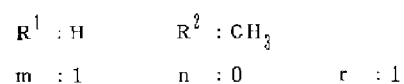
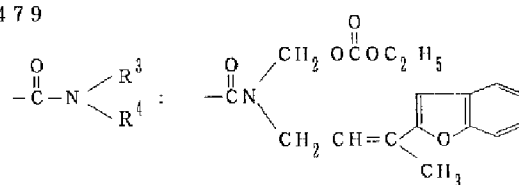
再結晶溶媒 : 酢酸エチル-ジイソプロピルエーテル

融点 : 181-182°C

形態 : 遊離

実施例 479

構造



結晶形 : 淡黄色針状

再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 109.5-110.5°C

形態 : 遊離

実施例 444 (回転異性体の混合物)

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 14, 1. 29 (9H, s), 1. 66, 2. 20 (3H, br s),
 2. 62, 2. 66 (3H, s), 4. 28, 4. 59 (2H, d,
 $J=7.2\text{Hz}$), 5. 45, 5. 73 (2H, s), 6. 38, 6. 52
 (1H, t, $J=7.2\text{Hz}$), 6. 57, 6. 71 (1H, s),
 7. 15-7. 35 (2H, m), 7. 4-7. 5 (1H, m), 7. 5-
 7. 6 (1H, m), 7. 76-7. 87 (2H, m), 8. 05-
 8. 15 (1H, m), 8. 55-8. 65 (1H, m)

実施例 455 (回転異性体の混合物)

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 06, 1. 19 (3H, t, $J=7\text{Hz}$), 1. 72, 2. 19 (3H,
 s), 2. 27, 2. 47 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 2. 65, 2. 66
 (3H, s), 4. 28, 4. 59 (2H, d, $J=7\text{Hz}$), 5. 44,
 5. 73 (2H, s), 6. 34, 6. 49 (1H, t, $J=7\text{Hz}$),
 6. 56, 6. 71 (1H, s), 7. 15-7. 35 (2H, m),
 7. 43 (1H, d, $J=8\text{Hz}$), 7. 53 (1H, d, $J=8\text{Hz}$),
 7. 70-7. 85 (2H, m), 8. 07 (1H, m), 8. 60
 (1H, m)

実施例 456 (回転異性体の混合物)

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 70, 2. 20 (3H, s), 2. 66 (3H, s), 3. 22,
 3. 55 (3H, s), 4. 19, 4. 58 (2H, d, $J=7\text{Hz}$),
 4. 68, 5. 12 (2H, s), 6. 43, 6. 51 (1H, t,
 $J=7\text{Hz}$), 6. 55, 6. 70 (1H, s), 7. 13-7. 30
 (2H, m), 7. 40-7. 60 (2H, m), 7. 70-7. 85
 (2H, m), 8. 10 (1H, m), 8. 60 (1H, m),

実施例 457 (回転異性体の混合物)

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 74, 2. 20 (3H, s), 2. 00, 2. 17 (3H, s),
 2. 66, 2. 67 (3H, s), 4. 29, 4. 59 (2H, d,
 $J=7\text{Hz}$), 5. 42, 5. 71 (2H, s), 6. 35, 6. 49
 (1H, t, $J=7\text{Hz}$), 6. 58, 6. 71 (1H, s), 7. 16-
 7. 33 (2H, m), 7. 40-7. 60 (2H, m), 7. 75-
 7. 86 (2H, m), 8. 07 (1H, m), 8. 61 (1H, m)

【1122】

【表261】

実施例 458

 $^1\text{H-NMR}$ ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm:

2. 14 (3H, s), 2. 70 (3H, s), 4. 23 (2H, t,
 $J=6\text{Hz}$), 6. 43 (1H, t, $J=6\text{Hz}$), 7. 08 (1H, s),
 7. 63 (1H, d, $J=9\text{Hz}$), 7. 80-8. 00 (3H, m),
 8. 20 (1H, m), 8. 23 (1H, s), 8. 48 (1H, m),
 9. 26 (1H, br)

実施例 479 (回転異性体の混合物)

 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ ppm:

1. 23, 1. 33 (3H, t, $J=7.0\text{Hz}$), 1. 74, 2. 21
 (3H, br s), 2. 66, 2. 67 (3H, s), 4. 08, 4. 25
 (2H, d, $J=7.0\text{Hz}$), 4. 30, 4. 62 (2H, d,
 $J=7.5\text{Hz}$), 5. 48, 5. 75 (2H, s), 6. 36, 6. 49
 (1H, t, $J=7.5\text{Hz}$), 6. 57, 6. 71 (1H, s),
 7. 15-7. 35 (2H, m), 7. 4-7. 6 (2H, m), 7. 75-
 7. 85 (2H, m), 8. 05-8. 15 (1H, m), 8. 55-
 8. 65 (1H, m)

【1123】実施例480

2- { [3-メチル-3- (ベンゾフラン-2-イル)-2-プロペニル] アミノカルボニル } -3-メチルキノキサリン-4-オキシド 0.6 g を塩化メチレン 40 ml に溶解し、4-ジメチルアミノピリジン 0.5 g、ジ-*n*-ブチルジカルボネート 0.6 g を加え、室温下 1 日攪拌した。反応液を希塩酸、飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出液：*n*-ヘキサン：酢酸エチル = 3 : 1）で精製後、*n*-ヘキサジエチルエーテルより再結晶して、0.6 g の 2- { *N*-*n*-ブトキシカルボニル-*N*- [3-メチル-3- (ベンゾフラン-2-イル)-2-プロペニル] アミノカルボニル } -3-メチルキノキサリン-4-オキシドを得た。

【1124】m. p. 119-121℃、白色粉末状。

【1125】適当な出発原料を用い、実施例480と同様にして前記実施例443、444及び451~453の化合物を得た。

【1126】実施例481

2- { [3-メチル-3- (ベンゾフラン-2-イル)-2-プロペニル] アミノカルボニル } -3-メチルキノキサリン-4-オキシド 1.0 g をテトラヒドロフラン 50 ml に懸濁し、アルゴン気流下、水素化ナトリウム 180 mg を加え、室温で 40 分攪拌した。氷冷下、エチルクロロホルメイト 440 mg を滴下し、室温で終夜攪拌した。反応液を氷水にあげ、ジクロロメタンにて抽出後、水、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムにて乾燥した。溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出液：塩化メチレン：メタノール = 400 : 1）で精製後、ジエチルエーテルで再結晶して 0.77 g の 2- { *N*-エトキシカルボニル-*N*- [3-メチル-3- (ベンゾフラン-2-イル)-2-プロペニル] アミノカルボニル } -3-メチルキノキサリン-4-オキシドを得た。

【1127】m. p. 124-125℃、淡黄色粒状。

【1128】適当な出発原料を用い、実施例481と同様にして前記実施例443、444、451、452及び454の化合物を得た。

【1129】実施例482

2- { [3-メチル-3- (ベンゾフラン-2-イル)-2-プロペニル] アミノカルボニル } -3-メチルキノキサリン-4-オキシド 1.0 g をジメチルホルムアミド 10 ml に懸濁し、氷冷下、水素化ナトリウム 180 mg を加え、室温で 15 分間攪拌した。メトキシメチルクロリド 320 mg を氷冷下滴下し、室温にて一夜攪拌した。反応混合物を氷水にあげ、酢酸エチルにて抽出後、水、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（溶出液：*n*-ヘキサン：酢酸エチ

ル = 4 : 1）で精製後、ジエチルエーテルにて再結晶して 0.23 g の 2- { *N*-メトキシメチル-*N*- [3-メチル-3- (ベンゾフラン-2-イル)-2-プロペニル] アミノカルボニル } -3-メチルキノキサリン-4-オキシドを回転異性体の混合物として得た。

【1130】m. p. 122-124℃、淡黄色粉末状
¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm; 1.70, 2.20 (3H, s), 2.66 (3H, s), 3.22, 3.55 (3H, s), 4.19, 4.58 (2H, d, J=7Hz), 4.68, 5.12 (2H, s), 6.43, 6.51 (1H, t, J=7Hz), 6.55, 6.70 (1H, s), 7.13~7.30 (2H, m), 7.40~7.60 (2H, m), 7.70~7.85 (2H, m), 8.10 (1H, m), 8.60 (1H, m)。

【1131】適当な出発原料を用い、実施例482と同様にして前記実施例443、444、451~455、457及び479の化合物を得た。

【1132】実施例483

水素化ナトリウム 92 mg のジメチルホルムアミド 20 ml 懸濁液に 2- { [3-メチル-3- (ベンゾフラン-2-イル)-2-プロペニル] アミノカルボニル } -3-メチルキノキサリン-4-オキシド 746 mg を加え室温で 30 分間攪拌した。ピバリン酸クロロメチル 32 μl 及び触媒量の沃化テトラ-*n*-ブチルアンモニウムを加え、1 時間攪拌した。反応混合物を水にあげ、酢酸エチルにて抽出した。水、飽和食塩水で洗浄後、乾燥した。溶媒を留去後、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーにて精製後、ジエチルエーテル-*n*-ヘキサンより再結晶して 300 mg の 2- { *N*-ピバロイルオキシメチル-*N*- [3-メチル-3- (ベンゾフラン-2-イル)-2-プロペニル] アミノカルボニル } -3-メチルキノキサリン-4-オキシドを回転異性体の混合物として得た。

【1133】m. p. 127-129℃、淡黄色針状晶
¹H-NMR (CDCl₃) δ ppm; 1.14, 1.29 (9H, s), 1.66, 2.20 (3H, br s), 2.62, 2.66 (3H, s), 4.28, 4.59 (2H, d, J=7.2Hz), 5.45, 5.73 (2H, s), 6.38, 6.52 (1H, t, J=7.2Hz), 6.57, 6.71 (1H, s), 7.15~7.35 (2H, m), 7.4~7.5 (1H, m), 7.5~7.6 (1H, m), 7.76~7.87 (2H, m), 8.05~8.15 (1H, m), 8.55~7.65 (1H, m)。

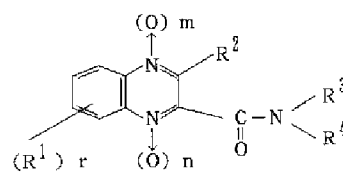
【1134】適当な出発原料を用い、実施例483と同様にして前記実施例443、451~457及び479の化合物を得た。

【1135】適当な出発原料を用い、前記実施例1~4と同様にして下記表262~表264に示す化合物を得

た。

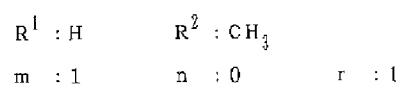
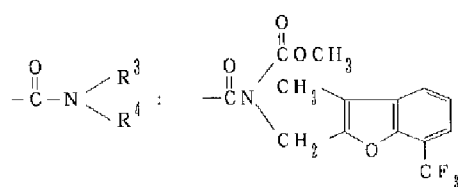
【1136】

【表262】



実施例 484

構造



結晶形 : 白色粉末状

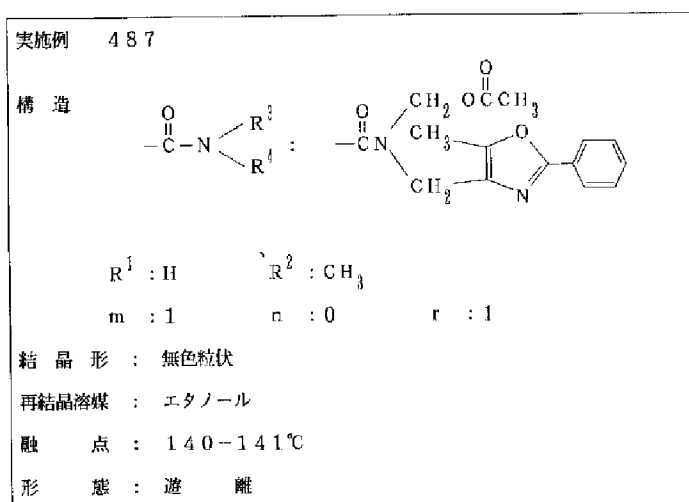
再結晶溶媒 : ジエチルエーテル

融点 : 129-134℃

形態 : 遊離

【1137】

【表263】



実施例 485 (回転異性体の混合物)

1H -NMR ($CDCl_3$) δ ppm :

1. 86, 1. 87 (3H, s), 2. 06, 2. 40 (3H, s),
2. 50, 2. 61 (3H, s), 4. 91, 5. 08 (2H, s),
5. 48, 5. 71 (2H, s), 7. 26-7. 40 (1H, m),
7. 50-7. 60 (1H, m), 7. 65-7. 75 (1H, m),
7. 75-7. 86 (2H, m), 7. 98-8. 15 (1H, m),
8. 55-8. 65 (1H, m)

実施例 487 (回転異性体の混合物)

1H -NMR ($CDCl_3$) δ ppm :

1. 98, 2. 11 (3H, s), 2. 15, 2. 53 (3H, s),
2. 64, 2. 69 (3H, s), 4. 60, 4. 80 (2H, s),
5. 55, 5. 72 (2H, s), 7. 40-7. 50 (3H, m),
7. 70-7. 80 (2H, m), 7. 85-8. 10 (3H, m),
8. 55-8. 65 (1H, m)

【1139】薬理試験方法

L6細胞による糖取り込み試験

L6細胞(ラット横紋筋由来)をMEM/10%FCS(子牛血清)で前培養した後48ウェルプレートに 4×10^4 個ずつ撒き2%FCS下で培養し筋肉細胞へ分化させる。6日目に供試化合物を添加した。7日目に培養液を除去した後 $[^3H]$ -2-デオキシグルコースを添加し、37℃で10分間反応させた。反応後冷リン酸緩

衝食塩水で2回洗浄し、0.1%ソディウムドデシルサルフェートで細胞を溶解させその放射活性を測定した。糖取り込み%は、コントロールを100%とし、供試化合物を添加したときの放射活性%として表わした。結果を下記表265及び266に示す。

【1140】

【表265】

供試化合物	投与量 (μM)	糖取り 込み%	供試化合物	投与量 (μM)	糖取り 込み%
実施例29の化合物	10^{-5}	201	実施例103の化合物	10^{-5}	198
実施例30の化合物	10^{-5}	210	実施例105の化合物	10^{-5}	186
実施例33の化合物	10^{-5}	120	実施例107の化合物	10^{-6}	206
実施例39の化合物	10^{-5}	159	実施例109の化合物	10^{-5}	222
実施例41の化合物	10^{-5}	181	実施例110の化合物	10^{-5}	209
実施例44の化合物	10^{-5}	176	実施例112の化合物	10^{-5}	159
実施例45の化合物	10^{-6}	147	実施例113の化合物	10^{-5}	123
実施例46の化合物	10^{-6}	217	実施例117の化合物	10^{-5}	228
実施例47の化合物	10^{-5}	148	実施例119の化合物	10^{-5}	158
実施例60の化合物	10^{-6}	166	実施例122の化合物	10^{-5}	199
実施例61の化合物	10^{-6}	154	実施例125の化合物	10^{-5}	188
実施例62の化合物	10^{-5}	223	実施例126の化合物	10^{-5}	212
実施例66の化合物	10^{-5}	154	実施例130の化合物	10^{-5}	161
実施例69の化合物	10^{-6}	194	実施例132の化合物	10^{-6}	187
実施例73の化合物	10^{-6}	168	実施例134の化合物	10^{-5}	125
実施例75の化合物	10^{-5}	249	実施例136の化合物	10^{-5}	129
実施例77の化合物	10^{-6}	245	実施例143の化合物	10^{-5}	210
実施例83の化合物	10^{-5}	153	実施例145の化合物	10^{-5}	136
実施例85の化合物	10^{-6}	177	実施例147の化合物	10^{-5}	138
実施例92の化合物	10^{-5}	201	実施例148の化合物	10^{-6}	183
実施例93の化合物	10^{-6}	240	実施例150の化合物	10^{-6}	203
実施例94の化合物	10^{-6}	188	実施例151の化合物	10^{-6}	156
実施例96の化合物	10^{-6}	200	実施例153の化合物	10^{-5}	191
実施例97の化合物	10^{-6}	136	実施例154の化合物	10^{-5}	163
実施例99の化合物	10^{-5}	154	実施例155の化合物	10^{-5}	212

【1141】

【表266】

供 試 化 合 物	投与量 (μg)	糖取り 込み%	供 試 化 合 物	投与量 (μg)	糖取り 込み%
実施例156の化合物	10^{-5}	155	実施例203の化合物	10^{-6}	239
実施例159の化合物	10^{-5}	152	実施例204の化合物	10^{-6}	192
実施例162の化合物	10^{-5}	187	実施例208の化合物	10^{-5}	125
実施例166の化合物	10^{-5}	168	実施例210の化合物	10^{-5}	145
実施例170の化合物	10^{-6}	165	実施例212の化合物	10^{-5}	121
実施例171の化合物	10^{-5}	163	実施例213の化合物	10^{-5}	146
実施例175の化合物	10^{-5}	123	実施例215の化合物	10^{-5}	186
実施例177の化合物	10^{-6}	178	実施例221の化合物	10^{-6}	120
実施例179の化合物	10^{-6}	200	実施例224の化合物	10^{-5}	135
実施例181の化合物	10^{-6}	223	実施例229の化合物	10^{-5}	149
実施例182の化合物	10^{-5}	150	実施例238の化合物	10^{-5}	144
実施例183の化合物	10^{-5}	212	実施例383の化合物	10^{-6}	168
実施例185の化合物	10^{-6}	169	実施例428の化合物	10^{-6}	128
実施例190の化合物	10^{-6}	193	実施例446の化合物	10^{-6}	183
実施例193の化合物	10^{-6}	121	実施例459の化合物	10^{-6}	127
実施例199の化合物	10^{-6}	165	実施例460の化合物	10^{-6}	158
実施例200の化合物	10^{-5}	142	実施例470の化合物	10^{-6}	204
実施例201の化合物	10^{-6}	207			

フロントページの続き

(72)発明者 三宅 将仁
徳島県板野郡北島町北村字神屋敷1番地
マスターズエル北島17号館102号
(72)発明者 曲田 清彦
徳島県板野郡松茂町中喜来字中瀬西ノ越39
番地の8

(72)発明者 吉田 英浩
徳島県徳島市八万町橋本304-4
(72)発明者 植山 篤則
徳島県徳島市北佐古一番町4番46号 グラ
ンドール北佐古403号
(72)発明者 西 孝夫
徳島県板野郡北島町太郎八須字外開2番地
の28